
PATENT ABSTRACTS OF JAPAN

(11)Publication number : 06-287171
(43)Date of publication of application : 11.10.1994

(51)Int.Cl.

C07C281/06
A01N 47/30
C07C337/06
C07D203/22
C07D207/325
C07D207/34
C07D207/408
C07D209/48
C07D213/50
C07D213/61
C07D213/75
C07D213/82
C07D231/12
C07D231/14
C07D231/16
C07D233/54
C07D233/68
C07D233/90
C07D249/14
C07D257/02
C07D261/08
C07D263/32
C07D271/06
C07D277/56
C07D295/22
C07D307/52
C07D309/04
C07D317/66
C07D333/22
C07D471/04
C07D471/04
C07D521/00

(21)Application number : 06-007657
(22)Date of filing : 27.01.1994

(71)Applicant : **TAKEDA CHEM IND LTD**
(72)Inventor : **UNEME HIDEKI**
UJIGAWA OSAMU
ISHIZUKA HITOSHI
OKAUCHI TETSUO

(30)Priority

Priority number : 05 19034 Priority date : 05.02.1993 Priority country : JP

(54) SEMICARBAZIDE DERIVATIVE, ITS PRODUCTION AND ITS INSECTICIDAL COMPOSITION

(57)Abstract:

R⁸

PURPOSE: To provide a new semicarbazide derivative having a highly strong insecticidal action and useful as a low toxic insecticide.

CONSTITUTION: A compound of formula I [R1, R8 are (substituted)cyclic hydrocarbon group, (substituted)heterocyclic group; R2, R4 are H, (substituted)hydrocarbon group, (substituted)acyl, etc.; R3, R5, R9 are H, (substituted)hydrocarbon group, etc.; R6, R7 are H, (substituted)acyl, etc.; A,B are H, oxygen, sulfur, etc.; X is oxygen atom, sulfur atom, etc.]. For example, 2-[2,3-bis(p-chlorophenyl)-3-oxopropyl]-4-(p-chlorophenyl)-1-(methoxyacetyl) semicarbazide. The compound of formula I is obtained by reacting a compound of formula II with a compound of formula III (when R9 is H) or a compound of formula IV (when R9 is not H).

LEGAL STATUS

[Date of request for examination]

[Date of sending the examiner's decision of rejection]

[Kind of final disposal of application other than the examiner's decision of rejection or application converted registration]

[Date of final disposal for application]

[Patent number]

[Date of registration]

[Number of appeal against examiner's decision of rejection]

[Date of requesting appeal against examiner's decision of rejection]

[Date of extinction of right]

Copyright (C); 1998,2003 Japan Patent Office

(19) 日本国特許庁 (J P)

(12) 公開特許公報 (A)

(11) 特許出願公開番号

特開平6-287171

(43) 公開日 平成6年(1994)10月11日

(51) IntCl. ⁵	識別記号	庁内整理番号	F I	技術表示箇所
C 0 7 C 281/06		7188-4H		
A 0 1 N 47/30	B	9159-4H		
	E	9159-4H		
	Z	9159-4H		
		9284-4C	C 0 7 D 209/ 48	

審査請求 未請求 発明の数10 O L (全 89 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号	特願平6-7657	(71) 出願人	000002934 武田薬品工業株式会社 大阪府大阪市中央区道修町四丁目1番1号
(22) 出願日	平成6年(1994)1月27日	(72) 発明者	采女 英樹 茨城県つくば市春日1丁目7番地の9 武 田春日ハイツ1104号
(31) 優先権主張番号	特願平5-19034	(72) 発明者	宇治川 治 茨城県つくば市松代3丁目12番地の1 武 田松代レジデンス502号
(32) 優先日	平5(1993)2月5日	(72) 発明者	石塚 仁 茨城県つくば市松代3丁目12番地の1 武 田松代レジデンス609号
(33) 優先権主張国	日本 (J P)	(74) 代理人	弁理士 岩田 弘 (外6名) 最終頁に続く

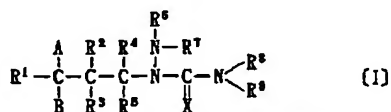
(54) 【発明の名称】 セミカルバジド誘導体、その製造法およびその殺虫組成物

(57) 【要約】

【目的】 優れた殺虫活性を有する新規なセミカルバジド誘導体、およびこれを含有する殺虫組成物の提供。

【構成】 式

【化1】



(R¹、R²は環状炭化水素基又は複素環基を、R³、R⁴はH、炭化水素基、複素環基、アシル基、O、S、N若しくはSiを介する基、CN又はハロゲンを、R⁵、R⁶、R⁷はH、炭化水素基、複素環基又はアシル基を、R⁸、R⁹はH、炭化水素基、複素環基又はアシル基を示すか、R³とR⁵、R⁴とR⁶、R⁸とR⁹で二価の基を、A、Bは隣接Cと共にCO、CS又は保護されたCOを示すか、あるいはA及びBはH又はO、S、Nを介する基を、XはO又はSを示す。)で表されるセミカルバジド誘導体又はその塩。

【効果】 優れた殺虫活性。

2

【化1】



10

10

10

 α α α α α α

れたカルボニル基を形成してもよく、Xが酸素原子または硫黄原子である請求項1記載のセミカルバジド誘導体またはその塩。

【請求項3】 R^1 、 R^2 および R^3 が同一または相異なり置換されていてもよいアリール基または置換されていてもよい芳香族複素環基で、 R^6 が置換されていてもよい低級アルキル基、置換されていてもよい低級脂肪族飽和カルボン酸アシル基または置換されていてもよい炭酸アシル基で、 R^7 が水素原子または置換されていてもよい低級アルキル基で、 R^8 、 R^4 、 R^5 および R^9 が水素原子である請求項1記載のセミカルバジド誘導体またはその塩。

【請求項4】 R^1 が①置換されていてもよい C_{6-14} アリール基または②置換されていてもよい窒素原子、酸素原子および硫黄原子から成る群から選ばれる1ないし5個のヘテロ原子と炭素原子を含有する3ないし13員の芳香族複素環基で、 R^2 が①水素原子、② C_{1-6} アルキル基、③ C_{3-7} シクロアルキル基、④置換されていてもよい C_{6-14} アリール基、⑤置換されていてもよい C_{7-15} アラールキル基、⑥置換されていてもよい窒素原子、酸素原子および硫黄原子から成る群から選ばれる1ないし5個のヘテロ原子と炭素原子を含有する3ないし13員の芳香族複素環基、⑦置換されていてもよい C_{6-14} アリールオキシ基、⑧ C_{1-6} アルコキシカルボニル基、⑨置換されていてもよい C_{6-14} アリールカルボニル基、10置換されていてもよいアミノ基、11 C_{1-6} アルキルチオ基、12 C_{6-14} アリールチオ基、13 C_{6-14} アリールスルフィニル基、14 C_{6-14} アリールスルホニル基、15 C_{6-14} アリールオキシスルホニル基または16トリ- C_{1-6} アルキルシリル基で、 R^3 が①水素原子または② C_{1-6} アルキル基で、 R^2 と R^3 は共に結合して C_{1-6} アルキレンまたは3-オキサペンタメチレンを形成してもよく、 R^4 が①水素原子、② C_{1-6} アルキル基または③置換されていてもよい C_{6-10} アリール基で、 R^5 が①水素原子または② C_{1-6} アルキル基で、 R^6 が①水素原子、② C_{3-7} シクロアルキル基、③ C_{1-6} アルキル基、④置換されていてもよい C_{1-6} アルキルカルボニル基、⑤ C_{2-4} アルケニルカルボニル基、⑥置換されていてもよい C_{6-14} アリールカルボニル基、⑦ C_{7-15} アラールキルカルボニル基、⑧置換されていてもよい C_{1-6} アルコキシカルボニル基、⑨置換されていてもよい C_{6-10} アリールオキシカルボニル基、10置換されていてもよい C_{7-15} アラールキルオキシカルボニル基、11置換されていてもよいカルバモイル基、12窒素原子、酸素原子および硫黄原子から成る群から選ばれる1ないし5個のヘテロ原子と炭素原子を含有する3ないし13員の芳香族複素環カルボニル基または13置換されていてもよいアミノチオカルボニル基で、 R^7 が①水素原子、② C_{1-6} アルキル基、③ C_{7-15} アラールキル基または④置換されていてもよい C_{1-6} アルキルカルボニル基で、 R^6 および R^7 は共に結合して C_{1-6}

アルキレン、サクシニル、フタロイル、3-オキサベンタメチレン、置換されていてもよいベンジリデンまたは $-\text{CH}=\text{N}-\text{N}=\text{CH}-$ を形成してもよく、 R^8 が①置換されていてもよい C_{6-10} アリール基または②置換されていてもよい窒素原子、酸素原子および硫黄原子から成る群から選ばれる1ないし5個のヘテロ原子と炭素原子を含有する3ないし13員の芳香族複素環基で、 R^9 が①水素原子、② C_{1-6} アルキル基または③ C_{1-7} シクロアルキル基で、 A が①水素原子、②ヒドロキシ基、③ C_{1-6} アルコキシ基、④ C_{6-14} アリールオキシ基、⑤ C_{1-6} アルコキシカルボニル基、⑥メルカプト基、⑦ C_{1-6} アルキルチオ基、⑧ C_{1-6} アルキルアミノ基、⑨ジ- C_{1-6} アルキルアミノ基、10 C_{6-14} アリールアミノ基で、 B が水素原子で、あるいは A および B が隣接する炭素原子と共にカルボニル基、チオカルボニル基、 $>\text{C}(\text{OCH}_3)_2$ 、 $>\text{C}(\text{OC}_2\text{H}_5)_2$ 、 $>\text{C}(\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O})$ 、 $>\text{C}(\text{SCH}_3)_2$ 、 $>\text{C}=\text{NN}(\text{CH}_3)_2$ 、 $>\text{C}=\text{NNHP h}$ または $>\text{C}=\text{NNHCO}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$ を形成し、 X が酸素原子または硫黄原子である請求項1記載のセミカルバジド誘導体またはその塩。

【請求項5】 R^1 が①置換されていてもよい C_{6-14} アリール基または②置換されていてもよい窒素原子、酸素原子および硫黄原子から成る群から選ばれる1ないし5個のヘテロ原子と炭素原子を含有する3ないし13員の芳香族複素環基で、 R^2 が①水素原子、②置換されていてもよい C_{6-14} アリール基、③置換されていてもよい C_{7-16} アラルキル基、④置換されていてもよい窒素原子、酸素原子および硫黄原子から成る群から選ばれる1ないし5個のヘテロ原子と炭素原子を含有する3ないし13員の芳香族複素環基、⑤置換されていてもよい C_{6-14} アリールオキシ基、⑥置換されていてもよいアミノ基、⑦ C_{6-14} アリールチオ基または⑧ C_{6-14} アリールスルホニル基で、 R^3 が①水素原子または② C_{1-6} アルキル基で、 R^4 が①水素原子、② C_{1-6} アルキル基または③置換されていてもよい C_{6-14} アリール基で、 R^5 が①水素原子または② C_{1-6} アルキル基で、 R^6 が①水素原子、② C_{1-6} アルキル基、③置換されていてもよい C_{1-6} アルキルカルボニル基、④置換されていてもよい C_{6-14} アリールカルボニル基、⑤置換されていてもよい C_{1-6} アルコキシカルボニル基、⑥置換されていてもよい C_{6-14} アリールオキシカルボニル基、⑦置換されていてもよいカルバモイル基または⑧置換されていてもよいアミノチオカルボニル基で、 R^7 が①水素原子、② C_{1-6} アルキル基または③ C_{7-16} アラルキル基で、 R^8 および R^9 は共に結合して C_{1-6} アルキレン、3-オキサベンタメチレン、置換されていてもよいベンジリデンまたは $-\text{CH}=\text{N}-\text{N}=\text{CH}-$ を形成してもよく、 R^8 が置換されていてもよい C_{6-14} アリール基で、 R^9 が①水素原子または② C_{1-6} アルキル基で、 A が①水素原子、②ヒドロキシ基、③ C_{1-6} アルコキシ基、④ C_{6-14} アリールオキシ基、⑤ C_{1-6}

アルコキシカルボニル基で、 B が水素原子で、あるいは A および B が隣接する炭素原子と共にカルボニル基、 $>\text{C}(\text{OCH}_3)_2$ 、 $>\text{C}(\text{OC}_2\text{H}_5)_2$ 、 $>\text{C}(\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O})$ 、 $>\text{C}(\text{SCH}_3)_2$ 、 $>\text{C}=\text{NN}(\text{CH}_3)_2$ 、 $>\text{C}=\text{NNHP h}$ または $>\text{C}=\text{NNHCO}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$ を形成し、 X が酸素原子または硫黄原子である請求項1記載のセミカルバジド誘導体またはその塩。

【請求項6】 R^1 が①置換されていてもよい C_{6-14} アリール基または②置換されていてもよい窒素原子、酸素原子および硫黄原子から成る群から選ばれる1ないし5個のヘテロ原子と炭素原子を含有する3ないし13員の芳香族複素環基で、 R^2 が①水素原子、②置換されていてもよい C_{6-14} アリール基または③置換されていてもよい窒素原子、酸素原子および硫黄原子から成る群から選ばれる1ないし5個のヘテロ原子と炭素原子を含有する3ないし13員の芳香族複素環基で、 R^3 、 R^4 および R^5 が水素原子で、 R^6 が① C_{1-6} アルキル基、②置換されていてもよい C_{1-6} アルキルカルボニル基、③置換されていてもよい C_{1-6} アルコキシカルボニル基、④置換されていてもよい C_{6-14} アリールオキシカルボニル基で、 R^7 が①水素原子または② C_{1-6} アルキル基で、 R^8 および R^9 は共に結合してベンジリデンを形成してもよく、 R^8 が置換されていてもよい C_{6-14} アリール基で、 R^9 が①水素原子または② C_{1-6} アルキル基で、 A がヒドロキシ基で、 B が水素原子で、あるいは A および B が隣接する炭素原子と共にカルボニル基を形成し、 X が酸素原子である請求項1記載のセミカルバジド誘導体またはその塩。

【請求項7】化合物〔I〕が、2-[2, 3-ビス(p-クロロフェニル)-3-オキソプロピル]-4-(p-クロロフェニル)-1-(メトキシアセチル)セミカルバジド、2-[2, 3-ビス(p-クロロフェニル)-3-オキソプロピル]-4-(p-クロロフェニル)-1-(エトキシカルボニル)セミカルバジド、2-[2, 3-ビス(p-クロロフェニル)-3-オキソプロピル]-1-(エトキシカルボニル)-4-[p-(トリフルオロメチル)フェニル]セミカルバジド、2-[2, 3-ビス(p-クロロフェニル)-3-オキソプロピル]-1-(エトキシカルボニル)-4-[p-(トリフルオロメトキシ)フェニル]セミカルバジド、2-[3-(p-クロロフェニル)-3-オキソ-2-(6-クロロ-3-ピリジル)プロピル]-1-(エトキシカルボニル)-4-[p-(トリフルオロメチル)フェニル]セミカルバジドまたは2-[2, 3-ビス(p-クロロフェニル)-3-オキソプロピル]-4-(p-クロロフェニル)-1-(エトキシカルボニル)-4-メチルセミカルバジドである請求項1記載のセミカルバジド誘導体またはその塩。

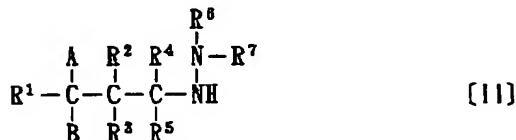
【請求項8】化合物〔I〕が、2-[2, 3-ビス(p-

5

ークロロフェニル) - 3-オキソプロピル) - 4- (p-クロロフェニル) - 1- (メトキシアセチル) セミカルバジドまたは2- (2, 3-ビス (p-クロロフェニル) - 3-オキソプロピル) - 4- (p-クロロフェニル) - 1- (エトキシカルボニル) セミカルバジドである請求項1記載のセミカルバジド誘導体またはその塩。

【請求項9】請求項1記載のセミカルバジド誘導体〔1〕またはその塩の製造法であって、式

〔化2〕



(式中の記号は請求項1記載と同意義を示す。) で表される化合物またはその塩と、(a) R⁶が水素の時、式

〔化3〕



(式中の記号は請求項1記載と同意義を示す。) で表される化合物とを、(b) R⁶が水素以外の時、式

〔化4〕



(式中、Yは脱離基を、他の記号は請求項1記載と同意義を示す。) で表される化合物とを反応させることを特徴とする製造法。

【請求項10】請求項1記載のセミカルバジド誘導体〔I〕またはその塩を含有することを特徴とする殺虫組成物。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【産業上の利用分野】本発明は、殺虫剤として有用なセミカルバジド誘導体またはその塩、その製造法およびそれを含有する殺虫剤に関する。

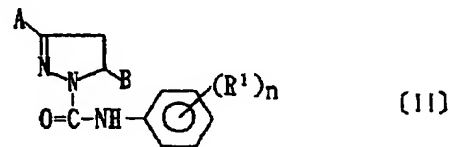
【0002】

【従来の技術】従来から多数の有害生物防除効果を有する合成化合物が殺虫剤として使用されているが、その大部分のものは有機リン酸エステル、カルバミン酸エステルあるいはピレスロイド系化合物に属している。このように限られた範囲の化合物が多用されることによって、例えば害虫の殺虫剤抵抗性の増大のような弊害が起こり、現に各地で問題となっていることは周知の通りである。また上記殺虫剤のいくつかのものは殺虫力が大きくても、人畜毒性や魚毒性が高く、時には害虫の天敵に対しても毒性を表したり、また土壌等への残留性が強すぎるなど、実用上は必ずしも満足できる結果が得られていないのが現状である。例えば、特開昭48-87028では、式

6

【0003】

〔化5〕



【0004】(式中、R¹はC₁₋₄アルキル基などを、AおよびBはそれぞれ低級アルキル基などを、nは1又は2を示す。) で表される殺虫化合物などが提案されているが、上記問題点を解決できるものではない。

【0005】

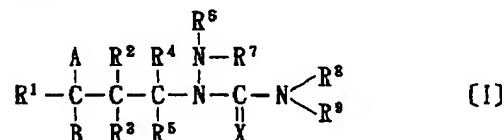
【発明が解決しようとする課題】本発明は、人畜毒性、魚毒性および天敵に対する毒性が低く、安全でかつ害虫に対して優れた防除効果を有する新規なセミカルバジド誘導体またはその塩、およびこれを含有する殺虫剤を提供することを目的とする。

【0006】

【課題を解決するための手段】本発明者らは上記課題を解決すべく、従来使用されてきた殺虫剤とは全く構造の異なった殺虫剤を見いだすため、長年鋭意研究を続けてきた。その結果、式

【0007】

〔化6〕



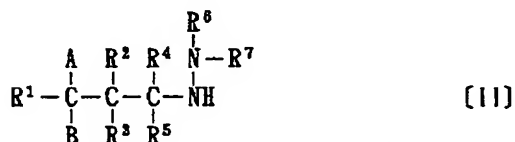
【0008】(式中R¹およびR⁸は同一または相異なり置換されていてもよい環状炭化水素基または置換されていてもよい複素環基を示し、R²およびR⁴は同一または相異なり水素原子、置換されていてもよい炭化水素基、置換されていてもよい複素環基、置換されていてもよいアシル基、酸素を介する基、硫黄を介する基、窒素を介する基、ケイ素を介する基、シアノ基またはハロゲン原子を示し、R³、R⁵およびR⁹は同一または相異なり水素原子、置換されていてもよい炭化水素基、置換されていてもよい複素環基または置換されていてもよいアシル基を示し、ここで、R²およびR³は共に結合して二価の基を形成してもよく、また、R⁴およびR⁵は共に結合して二価の基を形成してもよく、R⁶およびR⁷は同一または相異なり水素原子、置換されていてもよい炭化水素基、置換されていてもよい複素環基または置換されていてもよいアシル基を示すかまたは、R⁶およびR⁷が共に結合して二価の基を形成してもよく、AおよびBは隣接炭素原子と共にカルボニル基、チオカルボニル基または保護されたカルボニル基を形成するか、あるいはAは水素原子、酸素を介する基、硫黄を介する基または窒素を

介する基を、Bは水素原子を示し、Xは酸素原子または硫黄原子を示す。)で表される新規なセミカルバジド誘導体(以下単にセミカルバジド誘導体〔I〕または化合物〔I〕と称することがある。)またはその塩を合成し、そしてこの化合物が予想外にも非常に強い殺虫作用を有することを知見し、さらに毒性の低いことも知見し、これらに基づいてさらに研究した結果、本発明を完成するに至った。

【0009】即ち本発明は、(1)セミカルバジド誘導体〔I〕またはその塩、(2)セミカルバジド誘導体〔I〕またはその塩の製造法であって、式

【0010】

【化7】



【0011】(式中の記号は前記と同意義を示す。)で表される化合物(以下単に化合物〔II〕と称することがある。以下の化合物についても同様な略称をすることがある。)またはその塩と、(a) R⁶が水素原子の時、式

【0012】

【化8】



【0013】(式中の記号は前記と同意義を示す。)で表される化合物とを、(b) R⁶が水素原子以外の時、式

【0014】

【化9】



【0015】(式中、Yは脱離基を、他の記号は前記と同意義を示す。)で表される化合物とを反応させることを特徴とする製造法、および(3)セミカルバジド誘導体〔I〕またはその塩を含有することを特徴とする殺虫組成物に関する。

【0016】上記式中、R¹およびR⁶で示される「置換されていてもよい環状炭化水素基」の環状炭化水素基としては、例えばフェニル、ナフチル、アズレニル、アントリル、フェナントリル等のC₆-₁₄アリール基(好ましくはフェニル、ナフチルなどのC₆-₁₀アリール基)、例えばシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル等のC₃-₁₀シクロアルキル基(好ましくはC₃-₇シクロアルキル基)、例えばシクロプロベニル、シクロペンテニル、シクロヘキセニル等のC₃-₁₀シクロアルケニル基(好ましくはC₃-₇シクロアルケニル)

ル)等が用いられる。

【0017】R¹ないしR⁶で示される「置換されていてもよい複素環基」の複素環基としては、例えば窒素原子、酸素原子、硫黄原子などから成る群から選ばれる1ないし5個のヘテロ原子と炭素原子を含有する3ないし13員(好ましくは、3~9員、より好ましくは5ないし9員)の複素環基(好ましくは、芳香族複素環基)などが用いられ、その具体例としては、例えばチエニル(例、2-または3-チエニル)、フリル(例、2-または3-フリル)、ピロリル(例、1-, 2-または3-ピロリル)、ピリジル(例、2-, 3-または4-ピリジル)、オキサゾリル(例、2-, 4-または5-オキサゾリル)、チアゾリル(例、2-, 4-または5-チアゾリル)、ピラゾリル(例、1-, 3-, 4-または5-ピラゾリル)、イミダゾリル(例、1-, 2-, 4-または5-イミダゾリル)、イソオキサゾリル(例、3-, 4-または5-イソオキサゾリル)、イソチアゾリル(例、3-, 4-または5-イソチアゾリル)、オキサジアゾリル(例、3-または5-(1, 2, 4-オキサジアゾリル)、2-または5-(1, 3, 4-オキサジアゾリル)、チアジアゾリル(例、3-または5-(1, 2, 4-チアジアゾリル)、2-または5-(1, 3, 4-チアジアゾリル)、4-または5-(1, 2, 3-チアジアゾリル)、3-または4-(1, 2, 5-チアジアゾリル))、トリアゾリル(例、1-, 4-または5-(1, 2, 3-トリアゾリル)、1-, 3-または5-(1, 2, 4-トリアゾリル))、テトラゾリル(例、1-または5-(1H-テトラゾリル)、2-または5-(2H-テトラゾリル))、N-オキシド-2-, 3-または4-ピリジル、2-, 4-または5-ピリミジニル、N-オキシド-2-, 4-または5-ピリミジニル、3-または4-ピリダジニル、ピラジニル、N-オキシド-3-または4-ピリダジニル、インドリル、ベンゾフリル、ベンゾチアゾリル、ベンゾオキサゾリル、トリアジニル、オキソトリアジニル、イミダゾ[1, 2-a]ピリジニル、テトラゾロ[1, 5-b]ピリダジニル、トリアゾロ[4, 5-b]ピリダジニル、オキソイミダジニル、ジオキソトリアジニル、クロマニル、ベンゾイミダゾリル、キノリル、イソキノリル、シンノリル、フタラジニル、キナゾリニル、キノキサリニル、インドリジニル、キノリジニル、1, 8-ナフチリジニル、プリニル、プテリジニル、ジベンゾフラニル、カルバゾリル、アクリジニル、フェナントリジニル、フェナジニル、フェノチアジニル、フェノキサジニル、アジリジニル、アゼチジニル、ピロリニル、ピロリジニル、ピベリジニル、ピラニル、チオピラニル、1, 4-ジオキサニル、モルホリニル、モルホリノ、1, 4-チアジニル、1, 3-チアジニル、ピベラジニルなどが用いられる。

【0018】R²ないしR⁷およびR⁸で示される「置換されていてもよい炭化水素基」の炭化水素基としては、上記した環状炭化水素基の他に、例えばメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、s-ブチル、t-ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヘプチル、オクチル、ノニル、デシル、ウンデシル、ドデシル、トリ

デシル、テトラデシル、ペンタデシル等のC₁₋₁₅アルキル基（好ましくはC₁₋₆アルキル基などの低級アルキル基）、例えばビニル、アリル、2-メチルアリル、2-ブテニル、3-ブテニル、3-オクテニル等のC₂₋₁₀アルケニル基（好ましくはC₂₋₄アルケニル基）、例えばエチニル、2-プロピニル、3-ヘキシニル等のC₂₋₁₀アルキニル基（好ましくはC₂₋₄アルキニル基）、例えばベンジル、フェニルエチル、ナフチルメチル、ナフチルエチル等のC₇₋₁₅アラルキル基（好ましくはC₇₋₁₁アラルキル基）等が用いられる。

【0019】R²ないしR³およびR⁴で示される「置換されていてもよいアシル基」のアシル基としては、例えばホルミル、アセチル、プロピオニル、ブチリル、バレリル、イソバレリル、ピバロイル、ミリストイル等の炭素数1~15の脂肪族飽和カルボン酸アシル基（好ましくはC₁₋₆アルキルカルボニル基などの低級脂肪族飽和カルボン酸アシル基）、例えばアクリロイル、プロピオロイル、メタクリロイル、クロトノイル、オレオイル等の炭素数1~15の脂肪族不飽和カルボン酸アシル基（好ましくはC₂₋₄アルケニルカルボニル基）、例えばシクロプロパンカルボニル、シクロヘキサンカルボニル、フェニルアセチル、シンナモイル、ベンゾイル、ナフトイル等の炭素数1~15の炭素環式カルボン酸アシル基（好ましくは、C₃₋₇シクロアルキルカルボニル基、C₆₋₁₄アリールカルボニル基）、例えばフロイル、テノイル、ニコチノイル、イソニコチノイル等の複素環式カルボン酸アシル基（好ましくは、窒素原子、酸素原子、硫黄原子などから成る群から選ばれる1ないし5個のヘテロ原子と炭素原子を含有する3ないし13員の複素環カルボニル基）、例えばC₁₋₆アルコキシカルボニル（例えば、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、t-ブトキシカルボニル）、C₇₋₁₅アラルキルオキシカルボニル基（例えば、ベンジルオキシカルボニル）、C₆₋₁₄アリールオキシカルボニル基（例えば、フェノキシカルボニル、ナフチルオキシカルボニル）、複素環オキシカルボニル（例えば、ピリジルオキシカルボニルなどの窒素原子、酸素原子および硫黄原子などから成る群から選ばれる1ないし5個のヘテロ原子と炭素原子を含有する3ないし13員の複素環オキシカルボニル）等の炭酸アシル基、例えばカルバモイル、モノ-又はジ-C₁₋₆アルキルカルバモイル基（例えば、メチルカルバモイル、エチルカルバモイル、t-ブチルカルバモイル、ジメチルカルバモイル）、C₇₋₁₅アラルカルバモイル基（例えば、ベンジルカルバモイル）、C₆₋₁₄アリールカルバモイル（例えば、フェニルカルバモイル、ナフチルカルバモイル）等の置換されていてもよいカルバモイル基、スルフィノ基、例えばC₁₋₆アルキルスルホニル基（例えば、メチルスルホニル）、C₆₋₁₄アリールスルホニル基（例えば、フェニルスルホニル）、C₁₋₆アルコキシスルホニル基（例えば、メトキ

シルスルホニル）、C₆₋₁₄アリールオキシスルホニル基（例えば、フェノキシスルホニル）等の置換スルホニル基、スルホ基、スルフェノ基、例えばC₁₋₆アルキルスルフィニル基（例えば、メチルスルフィニル）、C₆₋₁₄アリールスルフィニル基（例えば、フェニルスルフィニル）などの置換スルフィニル基、例えばスルファモイル基、C₁₋₆アルキルスルファモイル基（例えば、メチルスルファモイル）、C₆₋₁₄アリールスルファモイル基（例えば、フェニルスルファモイル）等の置換されていてもよいスルファモイル基、ジエトキシホスホリル、メトキシフェニルホスホリル、ジフェニルホスホリル、ビス（ジメチルアミノ）ホスホリル等のリン酸アシル基等、およびこれらアシル基のチオアシル類縁体等が用いられる。

【0020】これらの炭化水素基（環状炭化水素基を含む）、複素環基およびアシル基は置換可能な位置に同一または相異なる置換基を1ないし5個程度有していてもよく、このような置換基としては、例えばメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、s-ブチル、t-ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヘプチル、オクチル、ノニル、デシル、ウンデシル、ドデシル、トリデシル、テトラデシル、ペンタデシル等のC₁₋₁₅のアルキル基（好ましくはC₁₋₆アルキル基、より好ましくはC₁₋₄アルキル基）、例えばシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル等のC₃₋₁₀シクロアルキル基（好ましくはC₃₋₇シクロアルキル基）、例えばビニル、アリル、2-メチルアリル、2-ブテニル、3-ブテニル、3-オクテニル等のC₂₋₁₀アルケニル基（好ましくはC₂₋₄アルケニル基）、例えばエチニル、2-プロピニル、3-ヘキシニル等のC₂₋₁₀アルキニル基（好ましくはC₂₋₄アルキニル基）、例えばシクロプロベニル、シクロペンテニル、シクロヘキセニル等のC₃₋₁₀シクロアルケニル基（好ましくはC₃₋₇シクロアルケニル基）、例えばフェニル、ナフチル等のC₆₋₁₄アリール基（好ましくはC₆₋₁₀アリール基）、例えばベンジル、フェニルエチル等のC₇₋₁₅アラルキル基（好ましくはC₇₋₁₁アラルキル基）、ニトロ基、ニトロソ基、ヒドロキシ基、メルカプト基、シアノ基、カルバモイル基、モノ-又はジ-C₁₋₆アルキルカルバモイル基、C₆₋₁₄アリールカルバモイル基（例えばフェニルカルバモイル）、カルボキシ基、例えばメトキシカルボニル、エトキシカルボニル等のC₁₋₆アルコキシカルボニル基、例えばフッ素、塩素、臭素、ヨウ素等のハロゲン原子、例えばメトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、イソブトキシ、s-ブトキシ、t-ブトキシ等のC₁₋₆アルコキシ基（好ましくはC₁₋₄アルコキシ基）、例えばフェノキシナフチルオキシ等のC₆₋₁₄アリールオキシ基、例えばメチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ、イソプロピルチオ、ブチルチオ、イソブチルチオ、s-ブチルチオ、t-ブチルチオ等のC₁₋₆アルキルチオ基

(好ましくはC₁₋₄アルキルチオ基)、例えばフェニルチオ等のC₆₋₁₄アリールチオ基(好ましくはC₆₋₁₀アリールチオ基)、スルフェノ基、例えばメチルスルフィニル、エチルスルフィニル、プロピルスルフィニル、イソプロピルスルフィニル、ブチルスルフィニル、イソブチルスルフィニル、s-ブチルスルフィニル、t-ブチルスルフィニル等のC₁₋₆アルキルスルフィニル(好ましくはC₁₋₄アルキルスルフィニル基)、例えばフェニルスルフィニル等のC₆₋₁₄アリールスルフィニル基(好ましくはC₆₋₁₀アリールスルフィニル基)、スルフィノ基、例えばメチルスルホニル、エチルスルホニル、プロピルスルホニル、イソプロピルスルホニル、ブチルスルホニル、イソブチルスルホニル、s-ブチルスルホニル、t-ブチルスルホニル等のC₁₋₆アルキルスルホニル基(好ましくはC₁₋₄アルキルスルホニル基)、例えばフェニルスルホニル等のC₆₋₁₄アリールスルホニル基(好ましくはC₆₋₁₀アリールスルホニル基)、スルホ基、例えばメトキシスルホニル、エトキシスルホニル、プロポキシスルホニル、イソプロポキシスルホニル、ブトキシスルホニル、イソブトキシスルホニル、s-ブトキシスルホニル、t-ブトキシスルホニル等のC₁₋₆アルコキシスルホニル(好ましくはC₁₋₄アルコキシスルホニル基)、例えばフェノキシスルホニル等のC₆₋₁₄アリールオキシスルホニル基(好ましくはC₆₋₁₀アリールオキシスルホニル基)、アミノ基、例えばアセチルアミノ、プロピオニルアミノ等のC₁₋₆アルキルカルボニルアミノ基、ベンゾイルアミノ等のC₆₋₁₄アリールカルボニルアミノ基(好ましくは、C₆₋₁₀アリールカルボニルアミノ基)、例えばメチルアミノ、エチルアミノ、プロピルアミノ、イソプロピルアミノ、ブチルアミノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ等のモノ-又はジ-C₁₋₆アルキルアミノ基、例えばシクロヘキシルアミノ等のC₃₋₇シクロアルキルアミノ基、例えばアニリノ等のC₆₋₁₄アリールアミノ基(好ましくはC₆₋₁₀アリールアミノ基)、例えばトリ-C₁₋₆アルキルシリル(例えば、トリメチルシリル、t-ブチルジメチルシリル)、トリ-C₆₋₁₀アリールシリル(例えば、トリフェニルシリル)、t-ブチルメトキシフェニルシリル等のトリ置換シリル基、例えばホルミル、アセチル、ベンゾイル等のC₁₋₁₅アシル基(好ましくはC₁₋₆アルキルカルボニル基、C₆₋₁₄アリールカルボニル基)、例えばチエニル(例、2-または3-チエニル)、フリル(例、2-または3-フリル)、ピロリル(例、1-, 2-または3-ピロリル)、ピリジル(例、2-, 3-または4-ピリジル)、オキサゾリル(例、2-, 4-または5-オキサゾリル)、チアゾリル(例、2-, 4-または5-チアゾリル)、ピラゾリル(例、1-, 2-, 3-, 4-または5-ピラゾリル)、イミダゾリル(例、1-, 2-, 4-または5-イミダゾリル)、イソオキサゾリル(例、3-, 4-または5-イソオキサゾリル)、イソチアゾリル(例、3-, 4-または5-イソチアゾリル)、トリアゾ

リル(例、1, 2, 3-または1, 2, 4-トリアゾリル)、ピリミジニル(例、2-, 4-または5-ピリミジニル)、ベンゾチアゾリル、ベンゾオキサゾリル、トリアジニル、オキシラニル、アジリジニル、ピロリジニル、ピペリジニル、モルホリニル、ベンゾイミダゾリル、キノリル、イソキノリル等の窒素原子、酸素原子、硫黄原子などから成る群から選ばれる1ないし5個のヘテロ原子と炭素原子を含有する3ないし13員(好ましくは5ないし9員)の複素環基(好ましくは芳香族複素環基)から選ばれる基などが用いられる。二つ以上の置換基が用いられる場合、これらのうちの二つの置換基が共に結合して、例えばC₁₋₆アルキレン(例えば、メチレン、エチレン、トリメチレン、テトラメチレン、プロペニレン)、3-オキサペンタメチレン、ビニレン、ベンジリデン、C₁₋₆アルキレンジオキシ(例えば、メチレンジオキシ)、2-チアトリメチレン、オキサリル、マロニル、スクシニル、マレオイル、フタロイル、酸素、硫黄、イミノ、アゾ、ヒドラゾ、-CH=N-N=CH-等の二価の基を形成していてもよい。これらの置換基が、例えばアリール、アラールキル、シクロアルキル、シクロアルケニル、アリールオキシ、アリールチオ、アリールスルフィニル、アリールスルホニル、アリールアミノ、アシル、複素環基、二価の基等である場合にはさらに上記のようなハロゲン原子、ヒドロキシ基、ニトロ基、シアノ基、例えばメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、s-ブチル、t-ブチル等のC₁₋₆アルキル基(好ましくはC₁₋₄アルキル基)、例えばビニル、アリル等のC₂₋₄アルケニル基、例えばエチニル、2-プロピニル等のC₂₋₄アルキニル基、例えばフェニル、ナフチルなどのC₆₋₁₄アリール基(好ましくはC₆₋₁₀アリール基)、C₁₋₄アルコキシ基、フェノキシなどのC₆₋₁₀アリールオキシ基、C₁₋₄アルキルチオ基、例えばフェニルチオ、ナフチルチオなどのC₆₋₁₄アリールチオ基(好ましくはC₆₋₁₀アリールチオ基)等で1ないし5個程度置換されていてよく、また置換基がアルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、アミノ、アルキルアミノ、シクロアルキルアミノ、アリールアミノ、トリ置換シリル等である場合にはさらに上記のようなハロゲン原子、水酸基、ニトロ基、シアノ基、C₁₋₆アルコキシ基(好ましくはC₁₋₄アルコキシ基)、C₁₋₆アルキルチオ(好ましくはC₁₋₄アルキルチオ基)等で1ないし5個程度置換されていてよい。

【0021】R²、R⁴およびAで示される「酸素を介する基」としては、酸素原子を通して結合する全ての基が該当するが、例えば式

【0022】

【化10】

R¹⁰-O-

【0023】(式中R¹⁰は水素原子、置換されていて

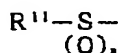
13

よい炭化水素基、置換されていてもよい複素環基、置換されていてもよいアシル基、またはケイ素を介する基を示す。)で表される基等が用いられる。ここでR¹⁰で示される炭化水素基、複素環基、アシル基およびそれらの置換基としては例えばR²等で示されたもの等が用いられ、ケイ素を介する基としてはケイ素原子を通して結合する全ての基が該当するが、例えばトリ-C₁₋₆アルキルシリル基(例えば、トリメチルシリル、t-ブチルジメチルシリル)、トリ-C₆₋₁₄アリールシリル基(例えば、トリフェニルシリル)、t-ブチルメトキシフェニルシリル等のトリ置換シリル基等が用いられる。シリル基の置換基としては、例えばR²等で示された炭化水素基や複素環基の置換基として前述したもの等が用いられる。「酸素を介する基」としては、例えば、ヒドロキシ基、C₁₋₆アルコキシ基、C₆₋₁₄アリールオキシ基(好ましくは、フェニルオキシなどのC₆₋₁₀アリールオキシ基)、C₁₋₆アルキルカルボニルオキシ基(例えば、アセチルオキシ)、C₁₋₆アルキルスルホニルオキシ基(例えば、メチルスルホニルオキシ)などが好ましい。

【0024】R²、R⁴およびAで示される「硫黄を介する基」としては、硫黄原子を通して結合する全ての基が該当するが、例えば式

【0025】

【化11】

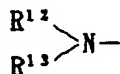


【0026】(式中R¹¹は水素原子、置換されていてもよい炭化水素基、置換されていてもよい複素環基、置換されていてもよいアシル基、酸素を介する基または窒素を介する基を示し、nは0、1または2を示す。)で表される基等が用いられる。ここでR¹¹で示される炭化水素基、複素環基、アシル基およびそれらの置換基としては例えばR²等で示されたもの等が用いられ、また酸素を介する基としては前述のR²、R⁴およびAで示される酸素を介する基等が用いられ、窒素を介する基としては後述するR²、R⁴およびAで示される窒素を介する基等が用いられる。nとしては、例えば0が好ましい。「硫黄を介する基」としては、例えば、C₁₋₆アルキルチオ基、C₆₋₁₄アリールチオ基(好ましくは、フェニルチオなどのC₆₋₁₀アリールチオ基)などが好ましい。

【0027】R²、R⁴およびAで示される「窒素を介する基」としては、窒素原子を通して結合する全ての基が該当するが、例えばニトロ基、ニトロソ基および式

【0028】

【化12】



【0029】(式中R¹²およびR¹³は同一または相異なる水素原子、置換されていてもよい炭化水素基、置換さ

14

れていてもよい複素環基または置換されていてもよいアシル基を示し、R¹²およびR¹³は共に結合して二価の基を形成してもよい。)等が用いられる。ここでR¹²およびR¹³で示される炭化水素基、複素環基、アシル基およびそれらの置換基としては例えばR²等で示されたもの等が用いられ、またR¹²およびR¹³が共に結合して形成する二価の基としては、例えばR²等で示された炭化水素基や複素環基の置換基として前述した置換されていてもよい二価の基等が用いられる。R¹²およびR¹³としては、それぞれ水素原子、C₁₋₆アルキル基、ハロゲン原子などで置換されていてもよいC₆₋₁₄アリール基、ハロゲン原子などで置換されていてもよいC₇₋₁₆アラールキル基、C₁₋₆アルキルカルボニル基、ハロゲン原子などで置換されていてもよいC₆₋₁₄アリールカルボニル基、C₁₋₆アルコキシカルボニル基、ハロゲン原子などで置換されていてもよいC₆₋₁₄アリールオキシカルボニル基などが好ましい。

【0030】R²およびR⁴で示される「ケイ素を介する基」としてはケイ素原子を通して結合する全ての基が該当するが、R¹⁰で示された基として前述したもの等が用いられる。「ケイ素を介する基」としては、例えばC₁₋₆アルキル基、C₆₋₁₄アリール基、C₁₋₆アルコキシ基などで置換されていてもよいシリル基などが用いられ、具体的にはシリル基、トリ-C₁₋₆アルキルシリル基(例えば、トリメチルシリル、t-ブチルシリル)、トリ-C₆₋₁₀アリールシリル(例えば、トリフェニルシリル)、t-ブチルメトキシフェニルシリルなどが好ましい。

【0031】R²およびR³、R⁴およびR⁵並びにR⁶およびR⁷が共に結合して形成する二価の基としては、例えばR²等で示された炭化水素基や複素環基の置換基として前述した置換されていてもよい二価の基等が用いられる。すなわち、例えばC₁₋₆アルキレン(例えば、メチレン、エチレン、トリメチレン、テトラメチレン、プロペニレン)、3-オキサペンタメチレン、ビニレン、ベンジリデン、C₁₋₆アルキレンジオキシ(例えば、メチレンジオキシ)、2-チアトリメチレン、オキサリル、マロニル、スクシニル、マレオイル、フタロイル、酸素、硫黄、イミノ、アゾ、ヒドラゾ、-CH=N-N=CH-等の二価の基などが用いられ、これらの基は、例えばハロゲン原子、ヒドロキシ基、ニトロ基、シアノ基、例えばメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、s-ブチル、t-ブチル等のC₁₋₆アルキル基、例えばビニル、アリル等のC₂₋₄アルケニル基、例えばエチニル、2-プロピニル等のC₂₋₄アルキニル基、例えばフェニル、ナフチルなどのC₆₋₁₄アリール基、C₁₋₆アルコキシ基、フェノキシなどのC₆₋₁₄アリールオキシ基、C₁₋₆アルキルチオ基、フェニルチオなどのC₆₋₁₄アリールチオ基等で1ないし5個程度置換されていてもよく、また置換基がアルキル、アルケニル、

アルキニル、アルコキシ、アリールオキシ、アルキルチオ、アリールチオ等である場合にはさらに上記のようなハロゲン原子、ヒドロキシ基、ニトロ基、シアノ基、C₁₋₆アルコキシ基、C₁₋₆アルキルチオ基等で1ないし5個程度置換されていてもよい。

【0032】A及びBが隣接する炭素原子と共に形成する保護されたカルボニル基としては、例えばアセタール類（例えば、ジメチルアセタール、ジエチルアセタール、1,3-ジオキサン、1,3-ジオキソラン）の他、モノチオ及びジチオアセタール類、シアノヒドリン類、ヒドラゾン類、オキシム類、イミン類等が用いられる。これらの具体例は、例えば種々の成書（例えば、プロテクティブグループブスインオーガニックシンセシス (Protective Groups in Organic Synthesis) 第二版、セオドラグリン及びピーターウッツ (Theodora W. Greene and Peter G. M. Wuts) 著、1991年 175~223頁、ジョンウィリーアンドサンズ社 (John Wiley & Sons, Inc.) (ニューヨーク) 等) に詳しく記載がある。具体的には、A、Bおよび隣接炭素原子で形成する保護されたカルボニル基としては、 $>C(OCH_3)_2$ 、 $>C(OC_2H_5)_2$ 、 $>C(OCH_2CH_2O)_2$ 、 $>C(SCH_3)_2$ 、 $>C=NN(CH_3)_2$ 、 $>C=NNHCO_2CH_2CH_2CH_3$ などが用いられる。

【0033】Xは酸素原子又は硫黄原子を示し、特に酸素原子が好ましい。

【0034】Yで示される脱離基としては、例えばフッ素、塩素、臭素、ヨウ素等のハロゲン原子または置換されていてもよいアシルオキシ基等が用いられる。ここで「置換されていてもよいアシルオキシ基」のアシル基及びその置換基としてはR²等で示された基として前述したもの等が用いられる。この場合、特に塩素などのハロゲン原子が好ましい。

【0035】本発明のセルカルバジド誘導体【I】における各記号の好ましい態様を以下に示す。

【0036】R¹としては、次の(1)~(4)群などが好ましい。

【0037】(1) ①置換されていてもよいアリール基（好ましくは、C₆₋₁₄アリール基）、②置換されていてもよい芳香族複素環基（好ましくは、窒素原子、酸素原子および硫黄原子から成る群から選ばれる1ないし5個のヘテロ原子と炭素原子を含有する3ないし13員の芳香族複素環基）など、

(2) ①ハロゲン原子、C₁₋₆アルキル基、ハロゲン原子で置換されたC₁₋₆アルキル基、C₁₋₆アルコキシ基、ハロゲン原子で置換されたC₁₋₆アルコキシ基、C₆₋₁₄アリールオキシ基、C₁₋₆アルキルチオ基、C₁₋₆アルキルスルフィニル基、C₁₋₆アルキルスルホニル基、C₁₋₆アルコキシスルホニル基、ハロゲン原子で置換されたC₁₋₆アルキルスルフィニル基、ハロゲン原子で置換されたC₁₋₆アルキルスルホニル基、ハロゲン原子で置換され

れたC₁₋₆アルコキシスルホニル基、C₆₋₁₄アリールオキシスルホニル基（好ましくは、C₆₋₁₄アリールオキシスルホニル基）、シアノ基などから成る群から選ばれる置換基で置換されていてもよいC₆₋₁₄アリール基（好ましくは、フェニル基）、②ハロゲン原子、C₁₋₆アルキル基、ハロゲン原子で置換されたC₁₋₆アルキル基、シアノ基、ニトロ基などから成る群から選ばれる置換基で置換されていてもよい窒素原子、酸素原子および硫黄原子から成る群から選ばれる1ないし5個のヘテロ原子と炭素原子を含有する3ないし13員の芳香族複素環基（好ましくは、チエニル、フリル、ピラゾリル、ピリジル、チアゾリル、イミダゾ [1,2-a] ピリジニルなどの5ないし9員の芳香族複素環基）など、

(3) ①ハロゲン原子、C₁₋₆アルコキシ基、ハロゲン原子で置換されたC₁₋₆アルコキシ基などから成る群から選ばれる置換基で置換されていてもよいC₆₋₁₄アリール基（好ましくは、フェニル基）、②ハロゲン原子で置換されていてもよい窒素原子、酸素原子および硫黄原子から成る群から選ばれる1ないし5個のヘテロ原子と炭素原子を含有する3ないし13員の芳香族複素環基（好ましくは、ピラゾリル、ピリジルなどの5ないし9員の芳香族複素環基）など、

(4) ①ハロゲン原子、C₁₋₆アルコキシ基、ハロゲン原子で置換されたC₁₋₆アルコキシ基などから成る群から選ばれる置換基で置換されていてもよいフェニル基、②ハロゲン原子で置換されていてもよいピリジル基など。

【0038】R²としては、次の(1)~(5)群などが好ましい。

【0039】(1) ①水素原子、②置換されていてもよいアリール基（好ましくは、C₆₋₁₄アリール基）、③置換されていてもよい芳香族複素環基（好ましくは、窒素原子、酸素原子および硫黄原子から成る群から選ばれる1ないし5個のヘテロ原子と炭素原子を含有する3ないし13員の芳香族複素環基）など、

(2) ①置換されていてもよいアリール基（好ましくは、C₆₋₁₄アリール基）、②置換されていてもよい芳香族複素環基（好ましくは、窒素原子、酸素原子および硫黄原子から成る群から選ばれる1ないし5個のヘテロ原子と炭素原子を含有する3ないし13員の芳香族複素環基）など、

(3) ①水素原子、②C₁₋₆アルキル基、③C₁₋₇シクロアルキル基、④ハロゲン原子、C₁₋₆アルキル基、ハロゲン原子で置換されたC₁₋₆アルキル基、C₁₋₆アルコキシ基、ハロゲン原子で置換されたC₁₋₆アルコキシ基、C₆₋₁₄アリールオキシ基、ハロゲン原子で置換されたC₆₋₁₄アリールオキシ基、C₁₋₆アルキルチオ基、C₁₋₆アルキルスルフィニル基、C₁₋₆アルコキシスルホニル、C₁₋₆アルキルスルホ基、ハロゲン原子で置換されたC₁₋₆アルキルスルフィニル基、ハロゲン原子で置換され

たC₁₋₆アルキルスルホニル基、ハロゲン原子で置換されたC₁₋₆アルコキシスルホニル基、シアノ基などから成る群から選ばれる置換基で置換されていてもよいC₆₋₁₄アリール基（好ましくは、フェニル、ナフチル）、⑤ハロゲン原子で置換されていてもよいC₇₋₁₅アラルキル基（好ましくは、C₇₋₁₁アラルキル基）、⑥ハロゲン原子、C₁₋₆アルキル基、ハロゲン原子で置換されたC₁₋₆アルキル基、C₆₋₁₄アリール基、C₁₋₆アルキルカルボニル基、C₁₋₆アルコキシ基、ハロゲン原子で置換されたC₁₋₆アルコキシ基、C₁₋₆アルコキシカルボニル基、モノ-又はジ-C₁₋₆アルキルカルバモイル基などから成る群から選ばれる置換基で置換されていてもよい窒素原子、酸素原子および硫黄原子から成る群から選ばれる1ないし5個のヘテロ原子と炭素原子を含有する3ないし13員の芳香族複素環基（好ましくは、チエニル、フリル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、ピリジル、イミダゾ [1,2-a] ピリジル、オキサゾリル、イソキサゾリル、オキサジアゾリル、チアゾリル、イソチアゾリルなど）、⑦ハロゲン原子で置換されていてもよいC₆₋₁₄アリールオキシ基、⑧C₁₋₆アルコキシカルボニル基、⑨ハロゲン原子、C₁₋₆アルキル基、ハロゲン原子で置換されたC₁₋₆アルキル基、ニトロ基、シアノ基などから成る群から選ばれる置換基で置換されていてもよいC₆₋₁₄アリールカルボニル基、10C₁₋₆アルキル基、C₆₋₁₄アリール基、ハロゲン原子で置換されたC₆₋₁₄アリール基、C₆₋₁₄アリールカルボニル基、C₁₋₆アルコキシカルボニル基などから成る群から選ばれる置換基で置換されていてもよいアミノ基、11C₁₋₆アルキルチオ基、12C₆₋₁₄アリールチオ基（好ましくは、C₆₋₁₀アリールチオ基）、13C₆₋₁₄アリールスルフィニル基（好ましくは、C₆₋₁₀アリールスルフィニル基）、14C₆₋₁₄アリールスルホニル基（好ましくは、C₆₋₁₀アリールスルホニル基）、15C₆₋₁₄アリールオキシスルホニル基（好ましくは、C₆₋₁₀アリールオキシスルホニル基）、16トリ-C₁₋₆アルキルシリル基（例えば、トリメチルシリルなど）など、

(4) ①水素原子、②ハロゲン原子、C₁₋₆アルキル基、ハロゲン原子で置換されたC₁₋₆アルキル基、C₁₋₆アルコキシ基、ハロゲン原子で置換されたC₁₋₆アルコキシ基、C₆₋₁₄アリールオキシ基、ハロゲン原子で置換されたC₆₋₁₄アリールオキシ基などから成る群から選ばれる置換基で置換されていてもよいC₆₋₁₄アリール基（好ましくは、フェニル、ナフチル）、③ハロゲン原子で置換されていてもよいC₇₋₁₅アラルキル基（好ましくは、ベンジル）、④ハロゲン原子で置換されていてもよい窒素原子、酸素原子および硫黄原子から成る群から選ばれる1ないし5個のヘテロ原子と炭素原子を含有する3ないし13員の芳香族複素環基（好ましくは、ピラゾリル、トリアゾリル、ピリジル、イミダゾ [1,2-a] ピ

リジル、チアゾリルなど）、⑤ハロゲン原子で置換されていてもよいC₆₋₁₄アリールオキシ基、⑥モノ-又はジ-C₁₋₆アルキルアミノ基、ハロゲン原子で置換されていてもよいフェニル基で置換されたアミノ基、フェニルカルボニル基で置換されたアミノ基、C₁₋₆アルコキシカルボニル基で置換されたアミノ基、C₁₋₆アルキル基およびフェニル基で置換されたアミノ基、C₁₋₆アルコキシカルボニル基およびフェニル基で置換されたアミノ基、⑦C₆₋₁₄アリールチオ基（好ましくは、フェニルチオなどのC₆₋₁₀アリールチオ基）、⑧C₆₋₁₄アリールスルホニル基（好ましくは、フェニルスルホニルなどのC₆₋₁₀アリールスルホニル基）など、

(5) ①水素原子、②ハロゲン原子、C₁₋₆アルキル基、ハロゲン原子で置換されたC₁₋₆アルキル基、C₁₋₆アルコキシ基、ハロゲン原子で置換されたC₁₋₆アルコキシ基などから成る群から選ばれる置換基で置換されていてもよいC₆₋₁₄アリール基、③ハロゲン原子で置換されていてもよい窒素原子、酸素原子および硫黄原子から成る群から選ばれる1ないし5個のヘテロ原子と炭素原子を含有する3ないし13員の芳香族複素環基（好ましくは、ピリジルなどの5ないし9員の芳香族複素環基）など、

【0040】R³としては、次の(1)または(2)群などが好ましい。

【0041】(1) ①水素原子、②C₁₋₆アルキル基（好ましくは、メチル）など、

(2) ①水素原子など。

【0042】R³とR⁴が共に結合して形成する二価の基としては、次の(1)群が好ましい。

【0043】(1) ①C₁₋₆アルキレン、②3-オキサペンタメチレンなど。

【0044】R⁴としては、次の(1)～(3)群などが好ましい。

【0045】(1) ①水素原子、②C₁₋₆アルキル基、③ハロゲン原子、C₁₋₆アルキル基、ハロゲン原子で置換されたC₁₋₆アルキル基などから成る群から選ばれる置換基で置換されていてもよいC₆₋₁₄アリール基など、

(2) ①水素原子、②C₁₋₆アルキル基、③ハロゲン原子で置換されていてもよいC₆₋₁₄アリール基など、

(3) 水素原子など。

【0046】R⁵としては、次の(1)または(2)群などが好ましい。

【0047】(1) ①水素原子、②C₁₋₆アルキル基など、

(2) ①水素原子など。

【0048】R⁶としては、次の(1)～(4)群などが好ましい。

【0049】(1) 置換されていてもよい低級アルキル基（好ましくは、C₁₋₆アルキル基）、②置換されていてもよい低級脂肪族飽和カルボン酸アルキル基（好ましく

は、C₁₋₆アルキルカルボニル基)、③置換されていてもよい炭酸アシル基(好ましくは、C₁₋₆アルコキシカルボニル、C₆₋₁₄アリールオキシカルボニル、C₇₋₁₅アラールキルオキシカルボニル、窒素原子、酸素原子および硫黄原子から成る群から選ばれる1ないし5個のヘテロ原子と炭素原子を含有する3ないし13員の複素環オキシカルボニル)など、

(2) ①水素原子、②C₃₋₇シクロアルキル基、③C₁₋₆アルキル基、④ハロゲン原子、C₁₋₆アルコキシ基、フェノキシ基、C₁₋₆アルキルチオ基、シアノ基などから成る群から選ばれる置換基で置換されていてもよいC₁₋₆アルキルカルボニル基、⑤C₃₋₄アルケニルカルボニル基、⑥ハロゲン原子、ニトロ基、ヒドロキシ-C₁₋₃アルキル基などから成る群から選ばれる置換基で置換されていてもよいC₆₋₁₄アリールカルボニル基、⑦C₇₋₁₅アラールキルカルボニル基、⑧ハロゲン原子で置換されていてもよいC₁₋₆アルコキシカルボニル基、⑨C₁₋₆アルキル基またはハロゲン原子で置換されたC₁₋₆アルキル基で置換されていてもよいC₆₋₁₀アリールオキシカルボニル基(好ましくは、フェノキシ)、10ハロゲン原子で置換されていてもよいC₇₋₁₅アラールキルオキシカルボニル基、11モノ-又はジ-C₁₋₆アルキル基、フェニル基、ハロゲン原子で置換されたフェニル基などから成る群から選ばれる置換基で置換されていてもよいカルバモイル基、12窒素原子、酸素原子および硫黄原子から成る群から選ばれる1ないし5個のヘテロ原子と炭素原子を含有する3ないし13員の芳香族複素環カルボニル基、13C₁₋₆アルキル基、フェニル基、ハロゲン原子で置換されたフェニル基などから成る群から選ばれる置換基で置換されていてもよいアミノチオカルボニル基など、

(3) ①水素原子、②C₁₋₆アルキル基、③ハロゲン原子、C₁₋₆アルコキシ基、フェノキシ基、C₁₋₆アルキルチオ基、シアノ基などから成る群から選ばれる置換基で置換されていてもよいC₁₋₆アルキルカルボニル基、④ハロゲン原子、ニトロ基、ヒドロキシ-C₁₋₃アルキル基などから成る群から選ばれる置換基で置換されていてもよいC₆₋₁₄アリールカルボニル基、⑤ハロゲン原子で置換されていてもよいC₁₋₆アルコキシカルボニル基、⑥C₁₋₆アルキル基またはハロゲン原子で置換されたC₁₋₆アルキル基などで置換されていてもよいC₆₋₁₄アリールオキシカルボニル基、⑦モノ-又はジ-C₁₋₆アルキル基、フェニル基、ハロゲン原子で置換されたフェニル基などから成る群から選ばれる置換基で置換されていてもよいカルバモイル基、⑧C₁₋₆アルキル基、フェニル基、ハロゲン原子で置換されたフェニル基などから成る群から選ばれる置換基で置換されていてもよいアミノチオカルボニル基など、

(4) ①C₁₋₆アルキル基、②ハロゲン原子、C₁₋₆アルコキシ基、フェノキシ基、C₁₋₆アルキルチオ基、シア

ノ基などから成る群から選ばれる置換基で置換されていてもよいC₁₋₆アルキルカルボニル基、③ハロゲン原子で置換されていてもよいC₁₋₆アルコキシカルボニル基、④C₁₋₆アルキル基またはハロゲン原子で置換されたC₁₋₆アルキル基などで置換されていてもよいC₆₋₁₄アリールオキシカルボニル基(好ましくは、フェノキシカルボニル)など、

【0050】R'としては、次の(1)~(4)群などが好ましい。

【0051】(1) ①水素原子、②置換されていてもよい低級アルキル基(好ましくは、C₁₋₆アルキル基)など、

(2) ①水素原子、②C₁₋₆アルキル基、③C₇₋₁₅アラールキル基、④C₁₋₆アルキルカルボニル基など、

(3) ①水素原子、②C₁₋₆アルキル基、③C₇₋₁₅アラールキル基など、

(4) ①水素原子、②C₁₋₆アルキル基など。

【0052】R⁶およびR'が共に結合して形成する二価の基としては、次の(1)~(3)群などが好ましい。

【0053】(1) C₁₋₆アルキレン、サクシニル、フタロイル、3-オキサペンタメチレン、ハロゲン原子またはニトロ基などで置換されていてもよいベンジリデン、-CH=N-N=CH-など、(2) C₁₋₆アルキレン、3-オキサペンタメチレン、ハロゲン原子またはニトロ基などで置換されていてもよいベンジリデン、-CH=N-N=CH-など、(3) ベンジリデンなど。

【0054】R⁸としては、次の(1)~(4)群などが好ましい。

【0055】(1) ①置換されていてもよいアリール基(好ましくは、C₆₋₁₄アリール基)、②置換されていてもよい芳香族複素環基(好ましくは、窒素原子、酸素原子および硫黄原子から成る群から選ばれる1ないし5個のヘテロ原子と炭素原子を含有する3ないし13員の芳香族複素環基)など、

(2) ①ハロゲン原子、C₁₋₆アルキル基、C₃₋₇シクロアルキル基、ハロゲン原子で置換されたC₁₋₆アルキル基、フェニル基、C₁₋₆アルコキシ基、ハロゲン原子で置換されたC₁₋₆アルコキシ基、C₁₋₆アルキルスルフィニル基、C₁₋₆アルキルスルホニル基、C₁₋₆アルコキシスルホニル基、ハロゲン原子で置換されたC₁₋₆アルキルスルホニル基、ハロゲン原子で置換されたC₁₋₆アルコキシスルホニル基、シアノ基、ニトロ基、C₁₋₃アルキレンジオキシ基、-SF₆などから成る群から選ばれる置換基で置換されていてもよいC₆₋₁₄アリール基、②ハロゲン原子で置換されていてもよい窒素原子、酸素原子および硫黄原子から成る群から選ばれる1ないし5個のヘテロ原子と炭素原子を含有する3ないし13員の芳香族複素環基(好ましくは、ピリジル、チアゾリル、イミダゾ [1,2-a] ピリジル)、③C₁₋₆アルキ

ル基など、

(3) ①ハロゲン原子、ハロゲン原子で置換されたC₁₋₆アルキル基、ハロゲン原子で置換されたC₁₋₆アルコキシ基などから成る群から選ばれる置換基で置換されていてもよいC₆₋₁₄アリール基、②C₁₋₆アルキル基など、

(4) ハロゲン原子、ハロゲン原子で置換されたC₁₋₆アルキル基、ハロゲン原子で置換されたC₁₋₆アルコキシ基などから成る群から選ばれる置換基で置換されていてもよいフェニル基など。

【0056】R⁹としては、次の(1)～(4)群などが好ましい。

【0057】(1) ①水素原子、②C₁₋₆アルキル基、③C₂₋₇シクロアルキル基など、

(2) ①水素原子、②C₁₋₆アルキル基など、

(3) ①水素原子、②メチル基など、

(4) 水素原子など。

【0058】Aとしては、次の(1)～(3)群などが好ましい。

【0059】(1) ①水素原子、②ヒドロキシ基、③C₁₋₆アルコキシ基、④C₆₋₁₄アリールオキシ基(好ましくは、フェノキシなどのC₆₋₁₀アリールオキシ基)、⑤C₁₋₆アルコキシカルボニル基、⑥メルカプト基、⑦C₁₋₆アルキルチオ基、⑧モノ-C₁₋₆アルキルアミノ基、⑨ジ-C₁₋₆アルキルアミノ基、⑩C₆₋₁₄アリールアミノ基(好ましくは、フェニルアミノ基)、⑪C₁₋₆アルキルスルホニルオキシ基(例えば、メチルスルホニルオキシなど)など、

(2) ①水素原子、②ヒドロキシ基、③C₁₋₆アルコキシ基、④C₆₋₁₄アリールオキシ基、⑤C₁₋₆アルコキシカルボニル基、⑥C₁₋₆アルキルスルホニルオキシ基

など、

(3) ヒドロキシ基など。

【0060】Bとしては、次の(1)群が好ましい。

【0061】(1) 水素原子など。

【0062】AおよびBが隣接する炭素原子と共に形成する基としては、次の(1)～(3)群が好ましい。

【0063】(1) カルボニル基、チオカルボニル基、 $>C(OCH_3)_2$ 、 $>C(OC_2H_5)_2$ 、 $>C(OCH_2CH_2O)_2$ 、 $>C(SCH_3)_2$ 、 $>C=NN(C_6H_5)_2$ 、 $>C=NNHPh$ または $>C=NNHCO_2CH_2CH_2CH_3$ など、(2) カルボニル基、 $>C(OC_6H_5)_2$ 、 $>C(OC_2H_5)_2$ 、 $>C(OCH_2CH_2O)_2$ 、 $>C(SCH_3)_2$ 、 $>C=NN(C_6H_5)_2$ 、 $>C=NNHPh$ または $>C=NNHCO_2CH_2CH_2CH_3$ など、(3) カルボニル基など。

【0064】Xは、次の(1)または(2)群が好ましい。

【0065】(1) 酸素原子または硫黄原子。

【0066】(2) 酸素原子。

【0067】本発明のセミカルバジド誘導体〔I〕の好ましい態様としては、上記した各記号の好ましい群を任意に組み合わせた化合物などが挙げられるが、より具体的には表1に示した各記号の組み合わせを有する化合物(A)～(D)などが好適である。化合物(B)は表4～表53に示されている全化合物を包含し、化合物(C)は後述する実施例で製造されている全化合物を包含し、化合物(D)は後述する試験例に用いられている全化合物を包含する。

【0068】

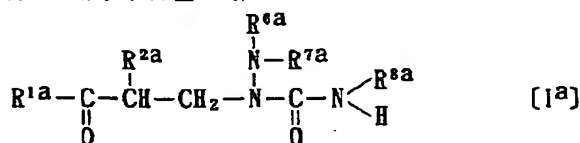
【表1】

化合物〔I〕の 各記号	化 合 物 〔I〕			
	(A)	(B)	(C)	(D)
R ¹	(1)	(2)	(3)	(4)
R ²	(1) または (2)	(3)	(4)	(5)
R ³	(1) または (2)	(1)	(2)	(2)
R ² とR ³ が結合 して形成する基	—	(1)	—	—
R ⁴	(1)	(1)	(2)	(2)
R ⁵	(1) または (2)	(1)	(1)	(2)
R ⁶	(1)	(2)	(3)	(4)
R ⁷	(1) または (2)	(2)	(2)	(3)
R ⁶ とR ⁷ が結合 して形成する基	—	(1)	(2)	(3)
R ⁸	(1)	(2)	(2)	(3)
R ⁹	(4)	(1)	(2)	(3)
A	(1)	(1)	(2)	(3)
B	(1)	(1)	(1)	(1)
AとBが結合 して形成する基	—	(1)	(2)	(3)
X	(1)	(1)	(1)	(2)

【0069】特に、R¹が①p-クロロフェニル基、②p-フルオロフェニル基、③p-(ジフルオロメトキシ)フェニル基または④6-クロロ-3-ピリジル基で、R²が①p-クロロフェニル基、②フェニル基、③p-クロロフェノキシ基、④6-クロロ-3-ピリジル基、⑤1-ピラゾリル基または⑥4-クロロ-1-ピラゾリル基で、R³が水素原子で、R⁴が水素原子で、R⁵が水素原子で、R⁶が①メチル基、②メトキシカルボニル基、③エトキシカルボニル基または④メトキシアセチル基で、R⁷が①水素原子（特に、R⁶がメチル基以外の時）または②メチル基（特に、R⁶がメチル基の時）*

*で、R⁸が①p-クロロフェニル基、②p-ブロモフェニル基、③p-(トリフルオロメチル)フェニル基または④p-(トリフルオロメトキシ)フェニル基で、R⁹が①水素原子または②メチル基で、AおよびBが隣接する炭素原子と共にカルボニル基を形成し、Xが酸素原子である化合物またはその塩が好ましい。

【0070】さらに、本発明のセミカルバジド誘導体〔I〕またはその塩の好ましい1例としては、例えば式【0071】
【化13】



【0072】（式中R^{1a}、R^{2a}及びR^{8a}は同一または相 50 異なり置換されていてもよいアリール基または置換され

25

ていてもよい芳香族複素環基を示し、 R^{6a} は置換されていてもよい低級アルキル基、置換されていてもよい低級脂肪族飽和カルボン酸アシル基または置換されていてもよい炭酸アシル基を示し、 R^{7a} は水素または置換されていてもよい低級アルキル基を示す。)で表される化合物またはその塩などもある。なかでも、 R^{1a} がハロゲン原子(例えば、塩素原子)、ハロゲン原子(例えば、フッ素原子)で置換されていてもよい C_{1-6} アルキル基(例えば、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル)またはハロゲン原子(例えば、フッ素原子)で置換されていてもよい C_{1-6} アルコキシ基(例えば、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ)で置換されていてもよいフェニル基またはピリジル基であり、 R^{2a} がハロゲン原子(例えば、塩素原子)で置換されていてもよいフェニル基または5ないし6員含窒素複素環基(例えば、ピリジル、ピラゾリル、トリアゾリルまたはチアゾリル)であり、 R^{3a} が水素原子、 C_{1-6} アルキル基(例えば、メチル)、 C_{1-6} アルコキシカルボニル基(例えば、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル)、 C_{1-6} アルキルカルボニル基(例えば、ホルミル、アセチル)、フェノキシカルボニル基、例えば C_{1-6} アルキル、フェニルまたはハロゲンフェニル(例えばp-クロロフェニル)で置換されていてもよいカルバモイル基またはチオカルバモイル基、ハロゲン原子(例えば、塩素原子)、ニトロ基、ヒドロキシ- C_{1-6} アルキル基で置換されていてもよいベンゾイル基であり、 R^{4a} が水素原子または C_{1-6} アルキル基(例えば、メチル、エチル)であり、 R^{5a} がハロゲン原子(例えば、塩素原子)、ハロゲン原子(例えば、フッ素原子)で置換されていてもよい C_{1-6} アルキル基(例えば、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル)またはハロゲン原子(例えば、フッ素原子)で置換されていてもよい C_{1-6} アルコキシ基(例えば、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ)で置換されていてもよいフェニル基である化合物またはその塩などがよく用いられ、特に上記化合物のうち、 R^{6a} が水素原子、 C_{1-6} アルキル基(例えば、メチル)、 C_{1-6} アルコキシカルボニル基(例えば、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル)、 C_{1-6} アルキルカルボニル基(例えば、ホルミル、アセチル)であり、 R^{1a} がハロゲン原子(例えば、フッ素原子)、トリフルオロメチルまたはトリフルオロメトキシで置換されたフェニル基である化合物またはその塩などが好ましい。

【0073】より具体的には、本発明のセミカルバジド誘導体【I】としては、後述する〔表4〕～〔表53〕に記載されている化合物No.1～化合物No.867が挙げられるが、なかでも例えば2-[2,3-ビス(p-クロロフェニル)-3-オキソプロピル]-4-(p-クロロフェニル)-1-(メトキシアセチル)セミカルバジド、2-[2,3-ビス(p-クロロフェニル)-3-オキソプロピル]-4-(p-クロロフェニル)

25

-1-(エトキシカルボニル)セミカルバジド、2-[2,3-ビス(p-クロロフェニル)-3-オキソプロピル]-1-(エトキシカルボニル)-4-[p-(トリフルオロメチル)フェニル]セミカルバジド、2-[2,3-ビス(p-クロロフェニル)-3-オキソプロピル]-1-(エトキシカルボニル)-4-[p-(トリフルオロメトキシ)フェニル]セミカルバジド、2-[3-(p-クロロフェニル)-3-オキソ-2-(6-クロロ-3-ピリジル)プロピル]-1-(エトキシカルボニル)-4-[p-(トリフルオロメチル)フェニル]セミカルバジドまたは2-[2,3-ビス(p-クロロフェニル)-3-オキソプロピル]-4-(p-クロロフェニル)-1-(エトキシカルボニル)-4-メチルセミカルバジドなどが好ましい。

【0074】セミカルバジド誘導体【I】またはその塩は場合によって立体異性体や互変異性体を生じることがあるが、これらいずれの異性体及びそれらの混合物も本発明化合物【I】またはその塩に含まれる。

【0075】セミカルバジド誘導体【I】の塩としては、農薬化学上許容な塩であればよく、例えば塩酸、臭化水素酸、ヨウ化水素酸、リン酸、硫酸、過塩素酸等の無機酸または、例えばギ酸、酢酸、酒石酸、リンゴ酸、クエン酸、シュウ酸、コハク酸、安息香酸、ピクリン酸、メタンスルホン酸、p-トルエンスルホン酸等の有機酸が用いられてもよい。また化合物【I】がカルボキシ基やスルホ基等の酸性基を有している場合、塩基との塩を形成させていてもよく、該塩基としては例えば、ナトリウム、カリウム、リチウム、カルシウム、マグネシウム、アンモニア等の無機塩基、例えばピリジン、コリジン、ジメチルアミン、トリエチルアミン、トリエタノールアミン等の有機塩基等が用いられる。化合物【I】は分子内塩を形成する場合もあり、その場合も本発明に含まれる。

【0076】セミカルバジド誘導体【I】またはその塩を殺虫剤として使用するにあたっては、一般の農薬の取り得る形態、即ち化合物【I】またはその塩の一種または二種以上を使用目的によって適当な液体の担体に溶解させるか分散させ、または適当な固体担体と混合させるか吸着させ、乳剤、油剤、水和剤、粉剤、粒剤、錠剤、噴霧剤、軟膏等の剤型として使用する。これらの製剤は必要ならば例えば乳化剤、懸濁剤、展着剤、浸透剤、湿潤剤、粘着剤、安定剤等を添加してもよく、自体公知の方法で調製することができる。

【0077】殺虫剤中の有効成分の含有割合は使用目的によって異なるが、通常、乳剤、水和剤等は1～90重量%程度、好ましくは5～70重量%程度が適当であり、油剤、粉剤等としては0.1～10重量%程度が適当であり、粒剤としては0.1～20重量%、好ましくは0.1～10重量%が適当であるが、使用目的によっては、これらの濃度を適宜変更してもよい。乳剤、水和

剤等は使用に際して、水などで適宜希釈増量（例えば100～100,000倍）して散布する。

【0078】使用する液体担体（溶剤）としては、例えば水、例えばメタノール、エタノール、プロパノール、イソプロパノール、エチレングリコール等のアルコール類、例えばアセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、例えばジオキサン、テトラヒドロフラン、エチレングリコールモノメチルエーテル、ジエチレングリコールモノメチルエーテル、プロピレングリコールモノメチルエーテル等のエーテル類、例えばケロシン、灯油、燃料油、機械油等の脂肪族炭化水素類、例えばベンゼン、トルエン、キシレン、ソルベントナフサ、メチルナフタレン等の芳香族炭化水素類、例えばジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、例えばN,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド等の酸アミド類、例えば酢酸エチル、酢酸ブチル、脂肪酸グリセリンエステル等のエステル類、例えばアセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類等の溶媒が適当であり、これらは一種または二種以上を適当な割合で混合して適宜使用することができる。固体担体（希釈・増量剤）としては、例えば大豆粉、タバコ粉、小麦粉、木粉等の植物性粉末、例えばカオリン、ベントナイト、酸性白土等のクレイ類、滑石粉、ロウ石粉等のタルク類、珪藻土、雲母粉等のシリカ類等の鉱物性粉末、炭酸カルシウム、アルミナ、硫黄粉末、活性炭等が用いられ、これらは一種または二種以上を適当な割合で混合して適宜使用することができる。

【0079】また軟膏基剤としては、例えばポリエチレングリコール、ベクチン、例えばモノステアリン酸グリセリンエステル等の高級脂肪酸の多価アルコールエステル、例えばメチルセルロース等のセルロース誘導体、アルギン酸ナトリウム、ベントナイト、高級アルコール、例えばグリセリン等の多価アルコール、ワセリン、白色ワセリン、流動パラフィン、豚脂、各種植物油、ラノリン、脱水ラノリン、硬化油、樹脂類等の一種または二種以上、あるいはこれらに下記に示す各種界面活性剤を添加したもの等が適宜使用される。

【0080】乳化剤、展着剤、浸透剤、分散剤等として使用される界面活性剤としては、必要に応じて石鹸類、ポリオキシエチレンアルキルアールエーテル類〔例、ノイゲン（商品名）、イー・エー142（E・A142（商品名））；第一工業製薬（株）製、ノナール（商品名）；東邦化学（株）製〕、アルキル硫酸塩類〔例、エマール10（商品名）、エマール40（商品名）；花王（株）製〕、アルキルスルホン酸塩類〔例、ネオゲン（商品名）、ネオゲンT（商品名）；第一工業製薬（株）製、ネオベレックス；花王（株）製〕、ポリエチレングリコールエーテル類〔例、ノニポール85（商品名）、ノニポール100（商品名）、ノニポール160（商品名）；三洋化成（株）製〕、多価アルコールエステル類〔例、トウイ

ーン20（商品名）、トウイーン80（商品名）；花王（株）製〕等の非イオン系及びアニオン系界面活性剤が適宜用いられる。

【0081】また、セミカルバジド誘導体〔I〕またはその塩と例えば他種の殺虫剤（ピレスロイド系殺虫剤、有機リン系殺虫剤、カルバメート系殺虫剤、天然殺虫剤など）、殺ダニ剤、殺線虫剤、除草剤、植物ホルモン剤、植物成長調節物質、殺菌剤（例えば銅系殺菌剤、有機塩素系殺菌剤、有機硫黄系殺菌剤、フェノール系殺菌剤など）、共力剤、誘引剤、忌避剤、色素、肥料等とを配合し、適宜使用することも可能である。

【0082】本発明化合物と混合して使用できる殺虫剤、殺ダニ剤、殺菌剤の代表例を以下に示す。プロボクスル（propoxur）、イソプロカルブ（isoprocab）、BPMC、キシリルカルブ（xylylcab）、メトルカルブ（metolcarb）、XMC、エチオフエンカルブ（ethiofen carb）、カルバリル（carbaryl）、ピリミカーブ（pirimicarb）、ベンジオカルブ（bendiocarb）、カルボフラン（carbofuran）、フラチオカルブ（furathiocarb）、カルボスルファン（carbosulfan）、アミノスルフラン（aminosulfuran）、メソミル（methomyl）、フェンチオン（fenthion）、フェニトロチオン（fenitrothion）、プロパホス（propaphos）、シアノホス（cyanophos）、プロチオホス（prothiofos）、スルプロホス（sulprofos）、プロフェノホス（profenofos）、EPN、シアノフェンホス（cyanofenphos）、アセフェート（acephate）、オキシデプロホス（oxydeprofos）、ジスルホトン（disulfoton）、チオメトン（thiometon）、フェントエート（phenthoate）、マラソン（malathion）、ジメトエート（dimethoate）、バミドチオン（vamidithion）、メカルバム（mecarbam）、トリクロルホン（trichlorphon）、ネイルド（naled）、ジクロルホス（dichlorvos）、クロロフェンビンホス（chlorofenvinphos）、テトラクロルビンホス（tetrachlorvinphos）、モノクロトホス（monocrotophos）、ホサロン（phosalone）、ジアリホス（dialifos）、クロルピリホス-メチル（chlorpyrifos-methyl）、クロルピリホス（chlorpyrifos）、ピリミホス-メチル（pirimiphos-methyl）、ダイアジノン（diazinon）、エトリムホス（etrimfos）、ピリダフェンチオン（pyridaphenthion）、キナルホス（quinalphos）、イソキサチオン（isoxathion）、メチダチオン（methidathion）、サリチオン（salithion）、シフルスリン（cyfluthrin）、パーメスリン（permethrin）、サイパーメスリン（cypermethrin）、デルタメスリン（deltamethrin）、シハロスリン（cyhalothrin）、フェンプロバスリン（fenpropathrin）、フェンバレート（fenvalerate）、フルシスリネート（flucythrinate）、フルバリネート（flubalinate）、カルタップ（cartap）、チオシクラム（thiocyclam）、ブプロフェジン（buprofezin）、ジフルベンズロン（difu

29

lbenzuron)、エトフェンプロックス(etofenprox)、フサライド(fthalide)、バリダマイシンA(validamycin A)、メプロニル(mepronil)、フルトラニル(flutolanil)、ジクロメジン(商品名diclomezine)、ペンシクロン(pencycuron)、エジフェンホス(edifenphos)、イソプロチオラン(isoprothiolane)、トリシクラゾール(tricyclazole)、プロベナゾール(probenazole)、カスガマイシン(kasugamycin)、IBP、ペンスタップ(bensultap)、ピラクロホス(pyraclorophos)、フェリムゾン(ferimzon)、イミダクロプリド(imidacloprid)、ニテンピラム(nitenpyram)、シグマサイバーメスリン(sigma-cypermethrin)、フィプロニル(fipronil)、シラフルオフエン(silafluofen)、ノバリュロン(novaluron)、ハイドロブレネ(hydroprene)、フルフェンプロックス(flufenprox)、テブフェンピラド(tebufenpyrad)、フェノキシカーブ(fenoxycarb)、フェナザキン(fenazaquin)、クロルフルアズロン(chlorfluazuron)、ジラルベンズロン(diflubenzuron)、テフルベンズロン(teflubenzuron)、ヘキサフルムロン(hexaflumuron)、フルフェノクスロン(flufenoxuron)、アラニカルブ(alanycarb)、ジアフェンチウロン(diafenthion)、クロフェンテジン(clofentezine)、フェンプロバトリン(fenprophathrin)、トラロメトリン(tralomethrin)、メトキサジアゾン(methoxadiazole)、フルアジナム(fluzinam)、オキメラノルア(okimeranolure)、クロルチオホス(chlorthiophos)、フォートレス(fortress)、レバミゾール(levamisol)、ジェノクロル(dienochlor)、クロエトカルブ(cloethocarb)、シクロプロトリン(cycloprothrin)、ベンフラカルブ(benfuracarb)、イソフェンホス(isofenphos)、アベルメクチン(ivermectin)、ミルベマイシン(milbemycin)、フェノチオカルブ(fenothiocarb)、シロマジン(cyromazine)、フルシクロクスロン(flucyclohexuron)、ブタチオホス(buthiophos)、フェンピロキシメート(fenpyroximate)、アクリナスリン(acrinathrin)、ベンフルスリン(benfluthrin)、ピリダベン(pyridaben)、ピリプロキシフェン(pyriproxyfen)、ヘキシチアゾクス(hexythiazox)、シクロプロトリン(cycloprothrin)、チェリトルア(cherrytlure)、スルフラミド(sulfluramid)、ダイアモルアー(diamolure)、チオジカルブ(thiodicarb)、フェンプロバスリン(fenprophathrin)、ディアフェンチウロン(diafenthion)、フェナリモール(fenarimol)、フルピリミドール(flurprimidol)、フルオトリマゾール(flutriazole)、トリアジメホン(triadimefon)、トリアジメノール(triadimenol)、ジクロブタゾール(diclobutazole)、バクロブタゾール(baclobutazol)、ジニコナゾール(diniconazole)、ウニコナゾール(uniconazole)、トリフルミゾール(triflumizole)、プロピコナ

30

ゾール(propiconazole)、フルトリアホル(flutriaol)、フルシラゾール(flusilazole)、ペンコナゾール(penconazole)、ブチオベート(butiobate)、プロクロラズ(prochloraz)、トリアベンセノール(triapenthenol)、EDDP、ピロキユロン(pyroquilon)、クロベンチアゾン(chlobenthiazole)、ジネブ(zineb)、マネブ(maneb)、TPN、キャプタン(captan)、キャプタフォル(captafol)、ホルベット(folpet)、ジクロルフルアニド(dichlorfluaniid)、カルボキシ(carboxin)、オキシカルボキシ(oxycarboxin)、ピラカルボリド(pyracarbolid)、メベニル(mebenil)、フルカルバニル(furcarbaniil)、シクラフラミド(cyclafuramid)、ベノダニル(benodanil)、グラノバックス(granovax)、チアベンダゾール(thiabendazole)、フベリダゾール(fuberidazole)、ベノミル(benomyl)、チオファネート-メチル(thiophanate-methyl)、サイベンダゾール(cypendazole)、カーベンダジン(carbendazim)、ジクロゾリン(dichlozolin)、イプロジオン(iprodione)、ビクロゾリン(vinclozolin)、プロシミドン(procymidone)、ミクロゾリン(myclozolin)、フタラキシル(ftalaxyl)、メタラキシル(metalaxyl)、オフレース(ofrace)、ベナラキシル(benalaxyl)、オキサデキシル(oxadixyl)、シプロフラム(cyprofuram)、トリデモルフ(tridemorph)、フェンプロピモルフ(fenpropimorph)、トリフォリン(triforine)、トリアリモル(triarimol)、フェナリモル(fenarimol)、ビテタノール(bitetanol)、イマザリル(imazalil)、エタコナゾール(etaconazole)、バクロブトラゾール(baclobutrazol)、フェナプロニル(phenapronil)、ビニコナゾール(viniconazole)、エチリモル(ehtirimol)、ジメチリモル(dimethirimol)、フルオロイミド(fluoroimid)、ヒメキサゾール(hymexazol)、エタゾール(ethazol)、プロキシクロル(proxychlor)、ピラゾホス(pyrazophos)、プロチオカーブ(prothiocarb)、アリエッティ(aliette)、フェンプロピディン(fenpropidin)、フラベナゾール(flapenazole)、ピリフェノックス(pyrifenoxy)、ジエトフェンカルブ(diethofencarb)、ピバニピリム(pipaniiprim)、クロジラコン(clozylacon)、ジフェノコナゾール(difenoconazole)、ジメトモルフ(dimethomorph)、フェンピクロニル(fenpiclonil)、チシオフエン(thicyofen)、プロムコナゾール(bromuconazole)、オプス(商品名、opus)、イプコナゾール(ipconazole)、ジメトコナゾール(dimetconazole)、ミクロブタニル(myclobutanil)、ミソチアゾール(mysothiazol)、チオイミコナゾール(thioimiconazole)、ザリラミド(zarilamid)、メトスルホバックス(metsulfovax)、ヘキサコナゾール(hexaconazole)、クインコナゾール(quinconazole)、テクロフタラム(tecloftalam)、トルクロホスメチル(t

olclofos-methyl)、フェンプロピディン (fenpropidin)、トリクラミド (triclamide)、フルスルファミド (flusulfamide)、ベフラン (befran)、シブロナゾール (cyproconazole)、テクロフトラム (tecloftalam)、フルコナゾール-シス (furconazole-cis)、フェネサニル (fenethanil)、ジメフルアゾール (dimelfluzole)、エチルトリアノール (ethyltrianol)、テブコナゾール (tebuconazole)、オキシソリニック酸 (oxolinic acid)、ピリミディフェン (pyrimidifen)、テブフェノジド (tebufenozide)、ピメトロジン (pymetrozin) 10、AC303、603、チフルザミド (thifluzamide)、BC723、ピリメタニル (pyrimethanil)、フルキンコナゾール (fluquinconazole)、フェンブコナゾール (fenbuconazole)、Ro15-2405、アムプロピルホス (ampropylfos)、メパニピリム (mepanipyrin)、メトコナゾール (metconazole)、テトラコナゾール (tetraconazole)、ペニルピロール (penylpyrrol) e)、トリアゾキシド (triazoxide)、テブコナゾール (tebuconazole)、デバカーブ (debacarb)、ミソチアゾール (myxothiazol)、テフルスリン (tefluthrin)、NC-170、NC-184、ドラウイン (drawin)、フルメスリン (flumethrin)、クロルエトキシホス (chlorethoxyfos)、フォスチアゼート (fosthiazate)、ゼーターメサイン (zetamethain)、チューリングエンシン (thuringiensin)、ベーターシフルスリン (beta-cyfluthrin)、シラフルオフェン (silaflofen)、フルプロキシフェン (fluproxyfen)、アルテミシディン (altemicidin)、プラレスリン (prallethrin)、ピリプロキシフェン (pyriproxyfen)、イミプロスリン (improthrin)、ルフエンウロン (lufenuron) 20等。

【0083】セミカルバジド誘導体【1】及びその塩は、衛生害虫、動植物寄生昆虫の防除に有効であって、害虫の寄生する動植物に直接散布するなど、昆虫に直接接触させることによって強い殺虫作用を示すが、場合によっては、薬剤を根、葉、茎等から植物に一旦吸収させた後、あるいは種子にコーティングして生育し、この植物を害虫が吸汁、咀嚼あるいはこれに接触することによって殺虫作用を示す。また化合物【1】及びその塩は植物に対する薬害も少なく、かつ魚類に対する毒性も低いなど、衛生用、園芸用、農業用害虫防除剤として安全かつ有利な性質を合わせ持っている。

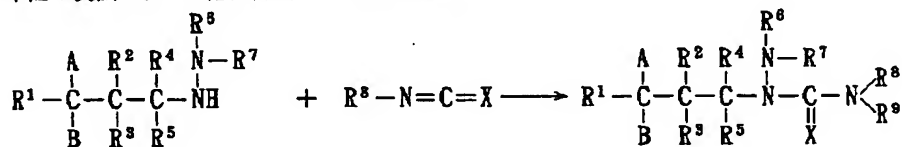
【0084】セミカルバジド誘導体【1】またはその塩を含有する製剤は、具体的には、例えばナガメ (Eurydema rugosum)、イネクロカメムシ (Scotinophara lurida)、ホソヘリカメムシ (Riptortus clavatus)、ナシゲンバイ (Stephanitis nashi)、ヒメトビウンカ (Laodelphax striatellus)、トビイロウンカ (Nilaparvata lugens)、ツマグロヨコバイ (Nephotettix cincticeps)、ヤノネカイガラムシ (Unaspis yanonensis)、ダイズアブラム

シ (Aphis glycines)、ニセダイコンアブラムシ (Lipaphis erysimi)、ダイコンアブラムシ (Brevicoryne brassicae)、ワタアブラムシ (Aphis gossypii)、オンシツコナジラミ (Trialeurodes vaporariorum)、タバココナジラミ (Bemisia tabaci)等の半翅目害虫、例えばハスモンヨトウ (Spodoptera litura)、シロイチモジヨトウ (Spodoptera exigua)、コナガ (Plutella xylostella)、モンシロチョウ (Pieris rapae crucivora)、ニカメイガ (Chilo suppressalis)、タマナギンウワバ (Autographa nigrisigna)、タバコガ (Helicoverpa assulta)、タバコバッドワーム (Heliothis virescens)、アワヨトウ (Pseudaletia separata)、ヨトウガ (Mamestra brassicae)、リンゴコカクモンハマキ (Adoxophyes orana fasciata)、ワタノメイガ (Notarcha derogata)、コブノメイガ (Cnaphalocrocis medinalis)、ジャガイモガ (Phthorimaea operculella)等の鱗翅目害虫、例えばチャノキイロアザミウマ (Scirtothrips dorsalis)、ミナミキイロアザミウマ (Thrips palmi)等のアザミウマ目害虫、例えばニジュウヤホシテントウ (Epilachna vigintioctopunctata)、ウリハムシ (Aulacophora femoralis)、キスジノミハムシ (Phyllotreta striolata)、イネドロオイムシ (Oulema oryzae)、イネゾウムシ (Echinocnemus squameus)、イネミズゾウムシ (Lissorhoptrus oryzophilus)、サザンコーンルートワーム (Diabrotica undecimpunctata)、コロラドイモハムシ (Leptinotarsa decemlineata)等の甲虫目害虫、例えばイエバエ (Musca domestica)、アカイエカ (Culex pipiens pallens)、ウシアブ (Tabanus trigonus)、タマネギバエ (Delia antiqua)、タネバエ (Delia platura)等の双翅目害虫、例えばトノサマバッタ (Locusta migratoria)、コバネイナゴ (Oxya japonica)、ケラ (Gryllotalpa africana)等の直翅目害虫、例えばチャバネゴキブリ (Blattella germanica)、クロゴキブリ (Periplaneta fuliginosa)等のゴキブリ科害虫、例えばダイコクシロアリ (Cryptotermes domesticus)、イエシロアリ (Coptotermes formosanus)、ヤマトシロアリ (Reticulitermes speratus)等のシロアリ目害虫、例えばナミハダニ (Tetranychus urticae)、ミカンハダニ (Panonychus citri)、カンザワハダニ (Tetranychus kanzawai)、ニセナミハダニ (Tetranychus cinnabarinus)、リンゴハダニ (Panonychus ulmi)、ミカンサビダニ (Aculops pelekassi)等のダニ目害虫、例えばイネシガラセンチュウ (Aphelenchoides besseyi)等の線虫類などの防除に有効である。なかでも、例えば上記した鱗翅目害虫、甲虫目害虫などの防除に特に高い効力を発揮する。

【0085】このようにして得られる本発明の殺虫剤は、毒性が極めて少なく安全で、優れた農薬である。そして本発明の殺虫剤は、従来の殺虫剤と同様の方法で用いることができ、その結果従来品に比べ優れた効果を発揮することができる。例えば本発明の殺虫剤は、対象の害虫に対して例えば育苗箱処理、作物の茎葉散布、虫体

散布、水田の水中施用あるいは土壌処理などにより使用することができる。そしてその施用量は、施用時期、施用場所、施用方法等に応じて広範囲に変えることができるが、一般的にはヘクタール当り有効成分（セミカルバジド誘導体〔I〕またはその塩）が0.3g～3,000g好ましくは50g～1,000gとなるように施用することが望ましい。また本発明の殺虫剤が水和剤である場合には、有効成分の最終濃度が0.1～1,000ppm好ましくは10～500ppmの範囲となるように希釈して使用すればよい。

【0086】セミカルバジド誘導体〔I〕またはその塩は次のような方法（A）～（D）等によって製造することができる。下記の製法によって化合物〔I〕（化合物*



〔II〕

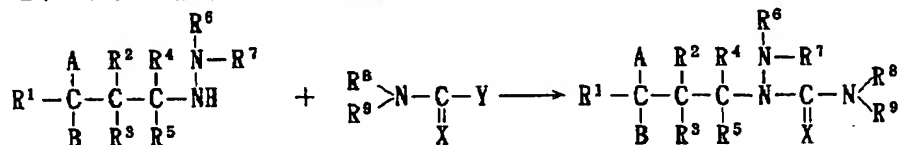
〔III〕

〔I〕（R⁹=H）

【0089】（式中の記号は前記と同意義を示す。ただしこの場合、化合物〔I〕のR⁹は水素である。）化合物〔II〕に対し化合物〔III〕は0.8～1.5当量用いるのが好ましいが、反応に支障がない場合には大過剰量用いてもよい。

【0090】本反応は、化合物〔II〕に対して0.01～2.0当量、好ましくは0.1～2当量の塩基の存在下で行うことにより反応が促進される場合もある。塩基性物質としては無機塩基も用いられるが、例えばトリエチルアミン、トリブチルアミン、N,N-ジメチルアニリン、ピリジン、ルチジン、コリジン、4-(ジメチルアミノ)ピリジン、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデセン-7（以下、DBUと略称する。）等の有機塩基の方が好ましい。上記有機塩基はそれ自体溶媒として用いることもできる。

【0091】反応は無溶媒で行ってもよいが、通常は適当な溶媒中で行われる。このような溶媒としては例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、例えばジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、例えばヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン等の飽和炭化水素類、例えばジエチルエーテル、テトラヒドロフラン（以下、THFと略称す※



〔II〕

〔IV〕

〔I〕（R⁹≠H）

【0095】（式中の記号は前記と同意義を示す。ただしこの場合、化合物〔I〕及び化合物〔IV〕のR⁹は水素ではない。）化合物〔II〕に対し化合物〔IV〕は0.

*〔I'〕及び〔I'〕を含む）が遊離の化合物で得られる場合は上記した様な塩に、また塩の形で得られる場合は遊離の化合物に、それぞれ常法に従って変換することができる。また原料化合物が上記したような塩となりうる場合も同様に遊離のままのみならず塩として用いることができる。従って、下記の製法に用いられる原料化合物及び生成物については、その塩（例えば上記化合物〔I〕で述べたような酸との塩等）も含めるものとする。

【0087】（A）化合物〔II〕と化合物〔III〕を反応させることにより化合物〔I〕が製造される。

【0088】

【化14】

20※る。）、ジオキサン等のエーテル類、例えばアセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、例えばアセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、例えばジメチルスルホキシド（以下、DMSOと略称する。）等のスルホキシド類、例えばN,N-ジメチルホルムアミド（以下、DMFと略称する。）、N,N-ジメチルアセトアミド等の酸アミド類、例えば酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類等が用いられる。本反応では非プロトン性の溶媒が好ましい。これらの溶媒は単独で用いることもできるし、また必要に応じて二種またはそれ以上の多種類を適当な割合例えば1:1～1:10の割合で混合して用いてもよい。

【0092】反応温度は通常、-20～250℃、好ましくは0～100℃、反応時間は通常、10分～100時間、好ましくは2～20時間の範囲である。化合物〔III〕のXが酸素のものの方が硫黄の場合より、通常反応が早い。

【0093】（B）化合物〔II〕と化合物〔IV〕とを反応させることにより、化合物〔I〕が製造される。

【0094】

【化15】

8～1.5当量用いるのが好ましいが、反応に支障がない場合には大過剰量用いてもよい。

【0096】本反応は、塩基の存在下で行って反応を有

36

*類、例えば酢酸、プロピオン酸等のカルボン酸類等が用いられる。これらの溶媒は単独で用いることもできるし、また必要に応じて二種またはそれ以上の多種類を適当な割合例えば1:1~1:10の割合で混合して用いてもよい。反応混合物が均一でない場合には例えばトリエチルベンジルアンモニウムクロリド、トリ α -オクチルメチルアンモニウムクロリド、トリメチルデシルアンモニウムクロリド、テトラメチルアンモニウムブロミド等の四級アンモニウム塩やクラウンエーテル類等の相間移動触媒の存在下に反応を行ってもよい。

【0098】反応温度は通常、 $-20\sim 250^{\circ}\text{C}$ 、好ましくは $10\sim 100^{\circ}\text{C}$ 、反応時間は通常、 $10\text{分}\sim 50\text{時間}$ 、好ましくは $2\sim 20\text{時間}$ の範囲である。

【0 1 0 0】

【化16】



※〔I〕に対し、還元剤を1～4当量用いるのが好ましいが、反応に支障がない場合にはそれ以上用いてもよい。

【0103】本反応の反応温度及び反応時間は用いる還元剤によって異なるが、通常 $-50\sim 100^{\circ}\text{C}$ 、反応時間は10分 \sim 20時間である。

【0105】

【化17】



としては例えばメトキシカルボニル、エトキシカルボニル、ベンジルオキシカルボニル、ホルミル、アセチル、メトキシメチル、ベンジルオキシメチル等が、 R^{11} と R^{14} が一緒になって示す基としては例えばフタロイル、ベンジリデン等が用いられる。このような基の脱保護化条件及び R^{14} （及び R^{11} ）のさらなる具体例は、例えばブ

ロテクティブグループスインオーガニックシンセシス (Protective Groups in Organic Synthesis) 第二版、セオドラグリーン及びピーターウッツ (Theodora W. Greene and Peter G. M. Wuts) 著、1991年 309~405頁、ジョンウィリーアンドサンズ社 (John Wiley & Sons, Inc.) (ニューヨーク) 等に詳しく記載されている。R⁶が水素でかつAとBが隣接炭素原子と一緒にカルボニル基を表す場合、化合物 [I⁶] は既に述べたような酸との塩であることが好ましい。

【0107】このようにして得られた化合物 [I] ([I⁶] 及び [I⁴] を含む) またはその塩は公知の手段、例えば濃縮、減圧濃縮、蒸留、分留、溶媒抽出、液性交換、転溶、クロマトグラフィー、結晶化、再結晶等により単離精製することができる。

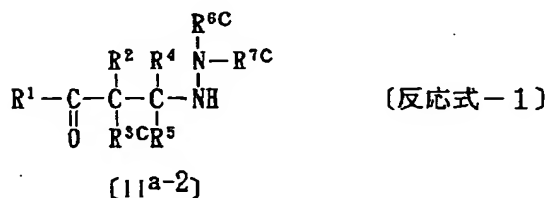
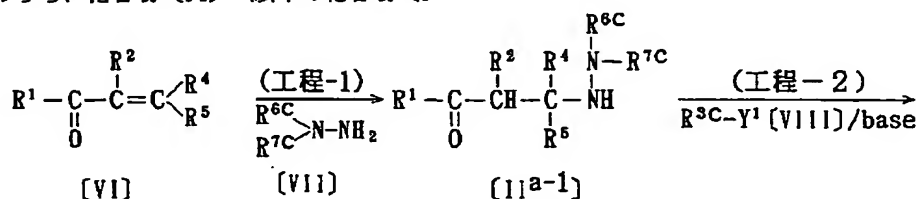
【0108】上記本発明方法の原料物質として使用される化合物のうち、化合物 [II] (以下の化合物 [I *

* I¹⁻¹], [II¹⁻²], [II¹⁻³], [II¹⁻⁴], [II¹], [II²], [II³], [II⁴], [II¹⁻¹], [II¹⁻²], [II¹⁻³], [II¹⁻⁴], [II²], [II³], [II⁴] 及び [II¹⁻²]) またはその塩は次のような方法 (i) ~ (x) 等によって製造することができる。これらの製造法中の原料はいずれも市販されているか、自体公知の方法または既に記述した製造法により製造できる。

【0109】(i) 化合物 [II] のAとBが隣接炭素原子と一緒にカルボニル基を示し、R⁶とR⁷のどちらも水素でないかあるいはR⁶が置換されていてもよいアシル基かつR⁷が水素の場合、該化合物 [II¹⁻¹] 及び [II¹⁻²] は例えば下記 [反応式-1] に従って製造できる。

【0110】

【化18】



【0111】(式中R⁶及びR⁷は同一または相異なり、それぞれR⁶及びR⁷で用いられたような置換されていてもよい炭化水素基、置換されていてもよい複素環基または置換されていてもよいアシル基を示すかまたはR⁶及びR⁷が一緒になってR⁶及びR⁷で用いられたような二価の基を示し、あるいはR⁶はR⁶で用いられたような置換されていてもよいアシル基を示しかつR⁷が水素を示し、R⁵はR⁵に同意義を示すが水素ではなく、Y¹はYとして用いられたような脱離基を示す。) ここで工程-1では化合物 [VI] と化合物 [VII] とを反応させることにより、化合物 [II¹⁻¹] が製造される。化合物 [VI] に対し化合物 [VII] は0.8~2当量用いるのが好ましいが、反応に支障がない場合には大過剰量用いてもよい。本工程は、化合物 [VI] に対して0.01~20当量、好ましくは0.1~2当量の塩基の存在下で行うことにより反応が促進される場合もある。塩基性物質としては方法 (B) で記述したような無機塩基や有機塩基が用いられる。上記有機塩基はそれ自体溶媒として用いることもできる。反応は無溶媒で行ってもよいが、通常は適当な溶媒中で行われる。このような溶媒と

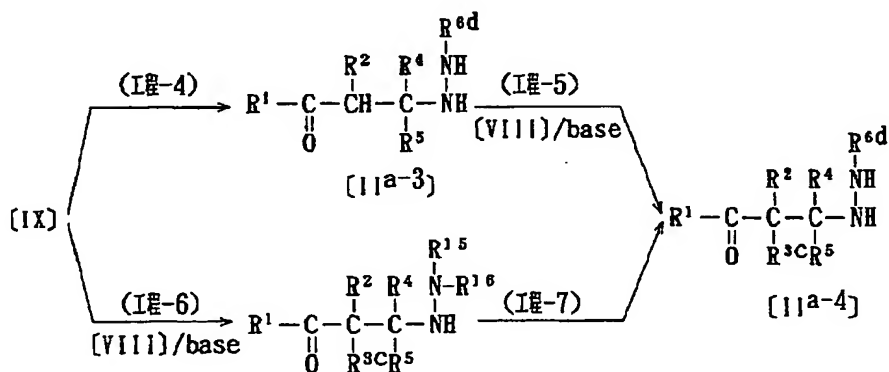
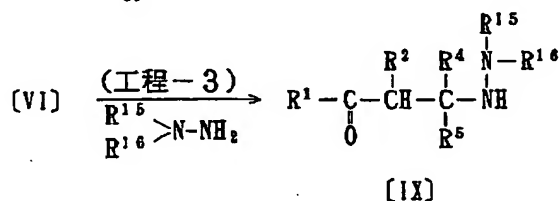
しては例えば方法 (B) で述べたような溶媒が用いられる。これらの溶媒は単独で用いることもできるし、また必要に応じて二種またはそれ以上の多種類を適当な割合例えば1:1~1:10の割合で混合して用いてもよい。反応混合物が均一でない場合には例えば方法 (B) で述べたような相間移動触媒の存在下に反応を行ってもよい。反応温度は通常、0~200℃、好ましくは10~100℃、反応時間は通常、10分~20日、好ましくは2時間~10日の範囲である。

【0112】工程-2では化合物 [II¹⁻¹] と化合物 [VII] とを方法 (B) と同様の条件で反応させ、化合物 [II¹⁻²] が製造される。

【0113】(ii) 化合物 [II] のAとBが隣接炭素原子と一緒にカルボニル基を示し、R⁶が水素、置換されていてもよい炭化水素基または置換されていてもよい複素環基を示し、R⁷が水素を示す場合、該化合物 [II¹⁻³] 及び [II¹⁻⁴] は例えば下記 [反応式-2] に従って製造できる。

【0114】

【化19】



〔反応式-2〕

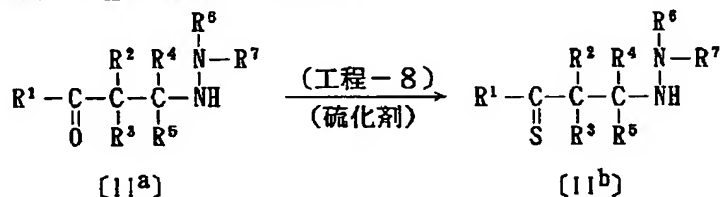
【0115】（式中R^{6a}は水素またはR⁶で用いられたような置換されていてもよい炭化水素基または置換されていてもよい複素環基を示し、R¹⁶はR^{6a}と同意義またはR¹⁶といっしょになってアミノ基の保護基を示し、R¹⁶は単独またはR¹⁶といっしょになってアミノ基の保護基を示し、他の記号は前記と同意義を示す。）ここで工程-3は〔反応式-1〕の工程-1に、工程-4及び工程-7は方法（D）に、工程-5及び工程-6は方法（B）にそれぞれ準じて反応させることができる。R¹⁶ 30（及びR¹⁶）で示されるアミノ基の保護基としては例え*

*ばR¹⁶（及びR¹⁶）で用いられたものを用いることができる。R^{6a}が水素の場合、化合物〔II^{a-1}〕及び〔I^{a-1}〕は化合物〔I〕の塩として既に述べたような酸との塩であることが好ましい。

【0116】（iii）化合物〔II〕のAとBが隣接炭素原子と一緒にチオカルボニル基を示す場合、該化合物〔II^b〕は例えば下記〔反応式-3〕に従って製造できる。

【0117】

〔化20〕



〔反応式-3〕

【0118】（式中の記号は前記と同意義を示す。）ここで工程-8で用いられる「硫化剤」としては、例えば硫化水素、五硫化リン、ローソン試薬（Lawesson's Reagent; 2,4-ビス(4-メトキシフェニル)-1,3-ジチア-2,4-ジホスフェタン-2,4-ジスルフィド）等がある。反応条件等は例えば新実験化学講座14-III巻1818~1820頁、1978年、丸善（東京）等に従うことができる。硫化剤が五硫化リンやローソン試薬の場合、化合物〔II^a〕に対して1~5当量の試薬をベンゼン、トルエン等の芳香

族炭化水素基やピリジン、ルチジン等の有機塩基中、20~150℃で2~20時間反応させるのが好ましい。

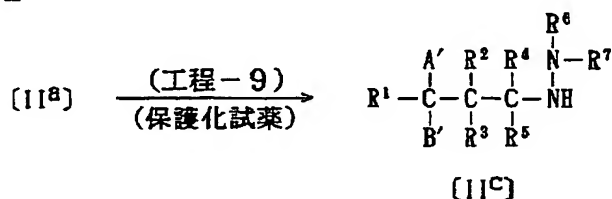
【0119】（iv）化合物〔II〕のAとBが隣接炭素原子と一緒にカルボニル基の保護基を示す場合、該化合物〔II^c〕は例えば下記〔反応式-4〕に従って製造できる。

【0120】

〔化21〕

41

42



〔反応式-4〕

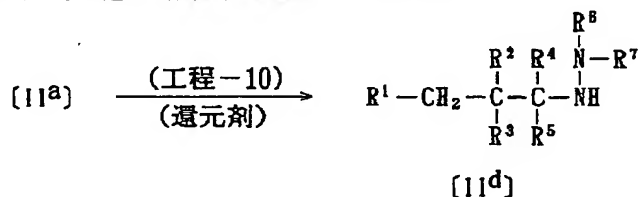
【0121】（式中A'及びB'は隣接炭素原子と一緒に
なってカルボニル基の保護基を示し、他の記号は前記
と同意義を示す。）ここで用いられる「保護基」や工程
-9で用いられる「保護化試薬」及びその反応条件とし
ては、例えばA及びBが隣接炭素原子と共に示すカルボ
ニル基の保護基の具体例のところで述べた成書等に記載*

*のものをを用いることができる。

【0122】(v) 化合物[II]のAとBが共に水素を
示す場合、該化合物[II^a]は例えば下記〔反応式-
5〕に従って製造できる。

【0123】

〔化22〕



〔反応式-5〕

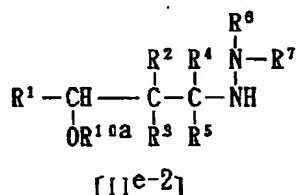
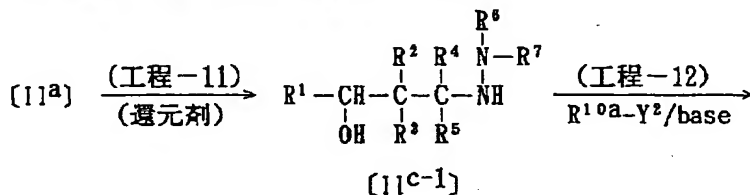
【0124】（式中の記号は前記と同意義を示す。）工
程-10は還元反応であり、いわゆるクレメンゼン(Cle
mmensen)還元やウォルフ-キッシュナー(Wolf-Kishner)
還元その他、化合物[II^a]のトシルヒドラゾンを水素化
リチウムアルミニウム等の金属水素化物で還元する方法
等が用いられる。還元試薬及びその反応条件等は、例え
ば新実験化学講座14-I巻10~16頁、1977年、丸善※

※（東京）等に記載のものをを用いることができる。

【0125】(vi) 化合物[II]のAが酸素を介する基
を示し、Bが水素を示す場合、該化合物[II^{a-1}]及び
[II^{a-2}]は例えば下記〔反応式-6〕に従って製造で
きる。

【0126】

〔化23〕



〔反応式-6〕

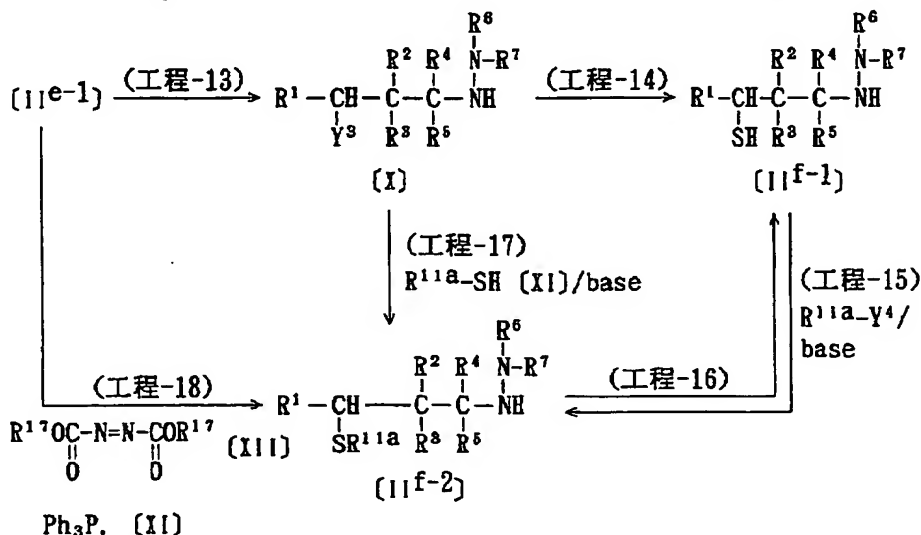
【0127】（式中R^{10a}はR¹⁰と同意義を示すが水素
ではなく、Y²はYとして用いられたような脱離基を示
し、他の記号は前記と同意義を示す。）ここで工程-1
1は方法(C)に、工程-12は方法(B)にそれぞれ
準じて反応させることができる。

【0128】(vii) 化合物[II]のAが硫黄を介する

基を示し、Bが水素を示す場合、該化合物[II^{a-1}]及
び[II^{a-2}]は例えば下記〔反応式-7〕に従って製造
できる。

【0129】

〔化24〕



〔反応式-7〕

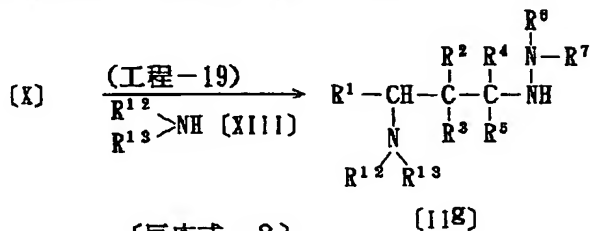
【0130】(式中 R^{11} は R^{11} と同意義を示すが水素ではなく、 R^{11} はメチル、エチル、イソプロピル等の低級アルキル基を示し、 Y^1 及び Y^4 は Y として用いられたような脱離基を示し、他の記号は前記と同意義を示す。)ここで工程-13は水酸基のハロゲン原子または p -トルエンスルホニルオキシ基等の置換されていてもよいアシル基への変換反応であり、例えば新実験化学講座14-I巻361~369頁、1977年、丸善(東京)または同14-III巻1793~1798等に記載の条件に従って反応させることができる。工程-14はハロゲン化物等からチオールへの変換反応であり、例えば新実験化学講座14-III巻1701~1708頁、1978年、丸善(東京)等に記載の条件に従って反応させることができる。工程-15及び工程-17は方法(B)にそれぞれ準じて反応させることができる。 R^{11} がチオールの保護基と考えられる場合、化合物 $[II'-1]$ は工程-16、すなわち R^{11} に応じた脱保護反応によっても化合物 $[II'-2]$ より製造できる。このような反応条件は種々の成書(例えば、プロテクティブグループスイノオーガニックシンセシス(Protective Groups in Organic Synthesis)第二版、セオドラグリーン及びピーターウッツ(Theodora W. Greene and Peter G. M. Wuts)著、1991年175~223頁、

*ジョンウィリーアンドサンズ社 (John Wiley & Sons, Inc.) (ニューヨーク)、新実験化学講座 14-III巻1702~1713頁、1978年、丸善(東京)等に記載されているもの等を用いることができる。工程-18は化合物 [XII] 及びトリフェニルホスフィンの存在下、化合物 [II^{α-1}] と化合物 [XI] とを縮合させる反応である。化合物 [II^{α-1}] に対し化合物 [XI]、[XII] 及びトリフェニルホスフィンそれぞれ0.8~3当量用いるのが好ましいが、反応に支障がない場合には大過剰量用いてもよい。本工程は無溶媒で行ってもよいが、通常は例えば方法(A)で述べたような非プロトン系の溶媒中で行われる。これらの溶媒は単独で用いることもできるし、また必要に応じて二種またはそれ以上の多種類を適当な割合で混合して用いてもよい。反応温度は通常、-20~200℃、好ましくは0~50℃、反応時間は通常、10分~10日、好ましくは30分~10時間の範囲である。

【0131】 (viii) 化合物(II)のAが窒素を介する基を示し、Bが水素を示す場合、該化合物(II')は例えば下記〔反応式-8〕に従って製造できる。

【0 1 3 2】

【化25】



〔反応式-8〕

【0133】（式中の記号は前記と同意義を示す。）こ
こで工程-19は方法（B）に準じて反応させることが

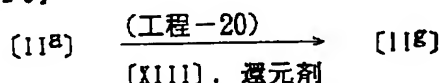
できる。

【0134】 (ix) 化合物 [II⁶] は例えば下記〔反応

式-9)に従っても製造できる。

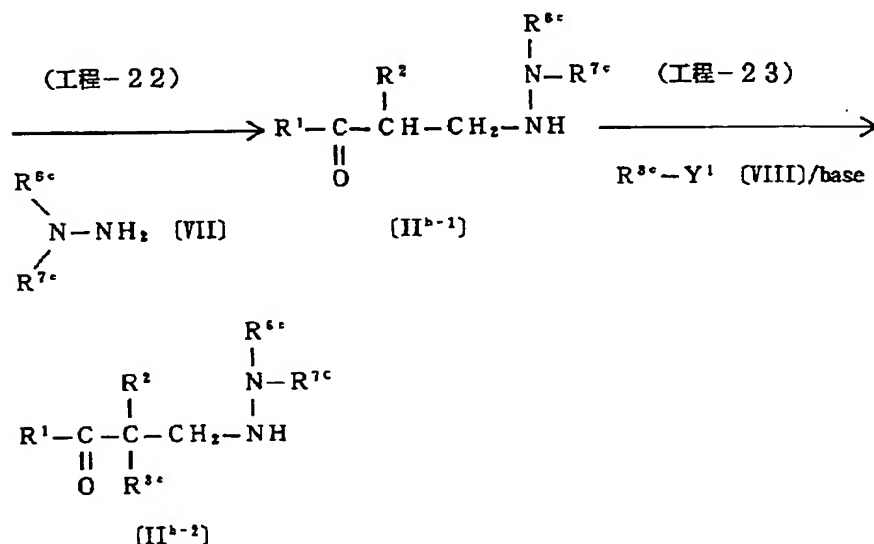
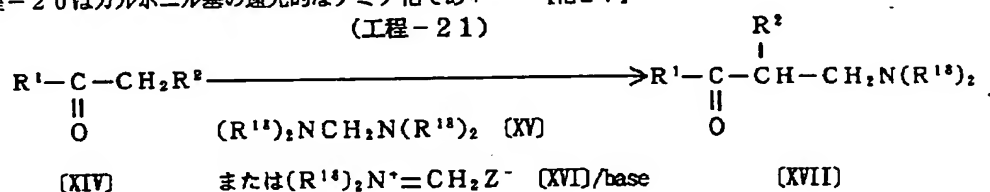
【0135】

【化26】



【反応式-9】

【0136】(式中の記号は前記と同意義を示す。)こ
こで工程-20はカルボニル基の還元的なアミノ化であ*
(工程-21)



【反応式-10】

【0139】(式中R^{1a}はメチル、エチル等の低級アルキル基を示すか、または(R^{1a})₂Nでピロリジノ、ピペリジノ、モルホリノ等の含窒素複素環基を示し、Zは塩素、臭素、ヨウ素等のハロゲン原子を示し、他の記号は前記と同意義を示す。)ここで工程-21では化合物[XIV]と化合物[XV]または化合物[XVI]とを反応させることにより、化合物[XVII]が製造される。化合物[XIV]と化合物[XV]とを反応させる場合は、【反応式-1】の工程-1と同様の反応条件で、化合物[XI

*り、還元剤、反応条件等は例えば新実験化学講座14-III巻1380~1385頁、1978年、丸善(東京)等に従うことができる。

【0137】(x)化合物[II]のAとBが隣接炭素原子と一緒にカルボニル基を示し、R⁶とR⁷のどちらも水素でないかあるいはR⁶が置換されていてもよいアシル基かつR⁷が水素を示し、R⁴及びR⁵が水素を示す場合、該化合物[II^{b-1}]及び[II^{b-2}]は例えば下記【反応式-10】に従って製造できる。

【0138】

【化27】

V)と化合物[XVI]とを塩基の存在下で反応させる場合は、方法(B)と同様の反応条件でそれぞれ行うことができる。また、工程-22は【反応式-1】の工程-1に、工程-23は方法(B)にそれぞれ準じて反応させることができる。

【0140】化合物[III]及び[IV]はいずれも一部公知であり、市販されているか自他公知の方法により製造できる。

【0141】化合物[V]は本発明化合物[I]に含ま

れる場合が多く、上記製造法(A)～(C)もしくはそれと類似の方法に従って製造できる。化合物(V)の原料も上記化合物(II)の製造法に準じて製造できる。

【0142】

【作用】セミカルバジド誘導体(I)及びその塩は、優れた殺虫作用を有しており、このことは次の試験例からも明かである。

【0143】〔試験例1〕ハスモンヨトウ(*Spodoptera litura*)に対する効果。

【0144】ダイズ幼植物(単葉展開期)に、供試化合物(下記実施例で得られる化合物のNo.で示す)5mgをトゥイーン(tween)20(商品名)を含む0.5mlの*

化合物No.	死虫率(%)
29	100
71	100
147	100
150	100
152	100
160	100
166	100
167	90
171	100
178	100
185	100
186	100
187	100
204	100
211	100
214	100
215	100
219	100
272	100
367	100
404	90
407	100
408	100
464	100
465	100

【0147】この〔表2〕から、本発明のセミカルバジド誘導体(I)またはその塩がハスモンヨトウに対して優れた殺虫効果を有していることが明らかである。

【0148】〔試験例2〕ニカメイガ(*Chilo suppressalis*)に対する効果

育苗箱で育てた三～四葉期イネ稚苗(6, 7本/株植え)の茎葉に、供試化合物(下記実施例で得られる化合物No.で示す)5mgをトゥイーン(tween)20(商品

*アセトンで溶解し、3000倍希釈のダイン(武田薬品工業(株)製の展着剤)水で所定濃度(100ppm)としてスプレーガンで薬液20ml/ポットを散布した。薬液が乾いた後、ダイズの単葉2枚を切り取り、アイスクリームカップに収め、ハスモンヨトウの3齢幼虫10頭を放ち、放虫後カップを室内(25℃)に置き、5日後の死亡虫を数えた。死虫率は次式より計算し、結果を〔表2〕に示した。

【0145】

死虫率(%) = 死虫数 / 放虫数 × 100

【0146】

〔表2〕

化合物No.	死虫率(%)
466	100
467	100
468	90
469	100
470	100
471	100
473	90
474	100
475	100
476	100
502	90
549	90
551	100
673	100
683	100
684	90
685	90
688	100
689	100
692	100
693	100
813	100
818	100
853	90

名)を含む0.5mlのアセトンで溶解し、3000倍希釈のダイン水で所定濃度(100ppm)としてスプレーガンで薬液20ml/ポットを散布した。薬液が乾いた後、イネ稚苗を試験管(直径3cm、高さ20cm)に水道水5mlと共に入れ、ニカメイガの3齢幼虫10頭を放った。この試験管を27℃の恒温室に収容し、放虫5日後に死亡虫を数え、食害程度を観察した。死虫率は試験例1に示した式より計算し、食害程度は以下の

基準によって判定し、結果を〔表3〕に示した。

【0149】食害指数

0：食害が認められない。

【0150】1：ごく僅かに（無処理区の1/10以下）食害が認められる。

【0151】2：無処理区の1/2未満の食害が認められる。

*

化合物No.	死虫率(%)	食害指数
25	90	1
29	100	0
72	90	2
147	90	2
150	100	0
152	100	0
155	100	2
185	100	0
186	90	2
187	100	2
211	100	0
214	100	1
219	100	0
239	100	0
241	100	0
248	100	1
251	100	1
270	100	3
272	100	1
274	100	1
278	90	3
289	90	2
403	100	0
404	100	0
408	100	0
464	30	0
465	100	0
467	100	1
468	100	0
469	100	2
473	100	0
474	100	0
475	100	0

*【0152】3：無処理区の1/2以上の食害が認められる。

【0153】4：無処理区と同レベルの食害が認められる。

【0154】

〔表3〕

化合物No.	死虫率(%)	食害指数
476	100	0
498	100	0
501	100	1
502	90	0
549	100	3
551	100	1
576	100	1
577	100	1
643	100	1
657	100	1
672	100	0
673	100	0
684	100	2
688	100	0
689	100	1
691	100	1
692	100	1
716	100	1
717	100	0
718	100	1
719	100	1
746	100	1
749	100	0
762	100	2
766	100	0
772	100	0
783	100	2
785	100	2
805	90	2
813	100	0
818	100	0
849	100	3
853	100	0

【0155】この〔表3〕から、本発明のセミカルバジド誘導体〔I〕またはその塩がニカメイガに対して優れた殺虫効果を有していることが明らかである。

【0156】

〔実施例〕次に実施例を挙げて、本発明をさらに詳しく

説明するが、本発明はこれらの実施例に限定解釈されるべきものではない。

【0157】実施例及び参考例のカラムクロマトグラフィーにおける溶出はTLC (Thin Layer Chromatography、薄層クロマトグラフィー) による観察下に行われ

51

た。TLC観察においては、TLCプレートとしてメルク (Merck) 社製のキーゼーゲル60F254 (70~230メッシュ) を、展開溶媒としてはカラムクロマトグラフィーで溶出溶媒として用いた溶媒を、検出法としてUV検出器を採用した。カラム用シリカゲルは同じくメルク社製のキーゼーゲル60 (70~230メッシュ) を用いた。NMRスペクトルはプロトンNMRを示し、内部基準としてテトラメチルシランを用いて、ブルカーAC-200P型スペクトロメーターで測定し、全δ値をppmで示した。IRスペクトルは島津IR-435赤外分光光度計を用い、クロロホルム中もしくはヌジョール中で測定し、波数 (cm⁻¹) で示した。展開溶媒として混合溶媒を用いる場合に () 内に示した数値は各溶媒の容量混合比である。

【0158】なお、下記参考例、実施例及び【表4】~【表53】で用いる略号は、次のような意義を有する。

【0159】Me: メチル基、Et: エチル基、Pr: プロピル基、i-Pr: イソプロピル基、Bu: ブチル基、t-Bu: t-ブチル基、Ac: アセチル基、Ph: フェニル基、Ms: メチルスルホニル基、s: シングレット、br: ブロード (幅広い)、d: ダブルレット、dd: ダブルレットダブルレット、t: トリプレット、q: クワルテット、m: マルチプレット、J: 結合定数、Hz: ヘルツ、CDCl₃: 重クロロホルム、DMSO-d₆: 重DMSO、%: 重量%、Mp.: 融点、Bp.: 沸点。また室温とあるのは約15~25℃を意味する。

【0160】【参考例1】4'-クロロ-2-(p-クロロフェニル) アクリロフェノン1g (3.61mmol)、ジエチルエーテル8mlの混合物に室温下N、N-ジメチルヒドラジン0.55ml (7.24mmol) を加え6時間攪拌した。反応液を水10mlで2回洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、濃縮し1.15gの4'-クロロ-2-(p-クロロフェニル)-3-(2,2-ジメチルヒドラジノ) プロピオフェノン (参-1) を黄色油状物として得た。

【0161】¹H-NMR(CDCl₃): 2.32(6H, s), 3.01(1H, dd, J=12.0, 5.1Hz), 3.63(1H, dd, J=12.0, 8.7Hz), 4.87(1H, dd, J=8.7, 5.1Hz), 7.27(4H, s), 7.35-7.40(2H, m), 7.87-7.92(2H, m)。

同様にして4'-クロロ-2-(p-クロロフェニル)-3-(モルホリノアミノ) プロピオフェン (参-2) を得た。

【0162】¹H-NMR(CDCl₃): 2.40-2.70(4H, m), 4.51(1H, dd, J=11.9, 4.3Hz), 3.35-3.63(2H, m), 3.81(1H, dd, J=11.9, 9.0Hz), 4.83(1H, dd, J=9.0, 4.3Hz), 7.21-7.42(6H, m), 7.91-7.97(2H, m)。

【参考例2】4'-クロロ-2-(p-クロロフェニル) アクリロフェノン0.5g (1.80mmol)、アセトニトリル10mlの混合物にカルバジン酸メチル0.33g (3.66mmol) を加え、室温下24時間攪拌し

52

た。濃縮後、残留物をジエチルエーテル20mlに溶かし、水10mlで2回洗浄した。無水硫酸マグネシウムで乾燥後、濃縮し、0.63gの4'-クロロ-2-(p-クロロフェニル)-3-[2-(メトキシカルボニル) ヒドラジノ] プロピオフェノン (参-3) を無色アモルファスとして得た。

【0163】¹H-NMR(CDCl₃): 3.10-3.23(1H, m), 3.61-3.82(1H, m), 3.65(3H, s), 4.75(1H, d, J=8.6, 5.4Hz), 6.12(1H, s), 7.18-7.39(6H, m), 7.82-7.88(2H, m)。

同様にして、4'-クロロ-2-(p-クロロフェニル)-3-(2-アセチルヒドラジノ) プロピオフェノン (参-4)、3-[2-(t-ブトキシカルボニル) ヒドラジノ]-4'-クロロ-2-(p-クロロフェニル) プロピオフェノン (参-5) を得た。

【0164】参-4 (無色アモルファス)

¹H-NMR(CDCl₃): 1.87(3H, s), 3.13(1H, dd, J=12.6, 5.1Hz), 3.64(1H, dd, J=12.6, 8.8Hz), 4.73(1H, d, J=8.8, 5.1Hz), 7.12-7.36(6H, m), 7.67(1H, s), 7.82-7.89(2H, m)。

参-5 (無色油状物)

¹H-NMR(CDCl₃): 1.41(9H, s), 3.14(1H, dd, J=12.4, 5.4Hz), 3.47(1H, br. s), 3.66(1H, dd, J=12.4, 8.7Hz), 4.75(1H, dd, J=8.7, 5.4Hz), 6.08(1H, s), 7.18-7.38(6H, m), 7.83-7.89(2H, m)。

【参考例3】4'-クロロ-2-(p-クロロフェニル) アクリロフェノン0.5g (1.80mmol)、アセトニトリル8mlの混合物にベンゾヒドラジド0.49g (3.60mmol) を加え、室温下24時間攪拌して50℃で30時間攪拌した。濃縮後、残留物をジエチルエーテルを加え不溶物をろ過した。ろ液を濃縮後、カラムクロマトグラフィー (展開溶媒: ヘキサン/酢酸エチル=1/1) で精製し、0.57gの3-(2-ベンゾイルヒドラジノ)-4'-クロロ-2-(p-クロロフェニル) プロピオフェノン (参-6) を無色のアモルファスとして得た。

【0165】¹H-NMR(CDCl₃): 3.25(1H, dd, J=12.6, 5.1Hz), 3.76(1H, dd, J=12.6, 8.7Hz), 4.60(1H, br. s), 4.80(1H, dd, J=8.7, 5.1Hz), 7.15-7.50(9H, m), 7.64-7.69(2H, m), 7.78-7.83(2H, m), 8.42(1H, s)。

【参考例4】4'-クロロ-2-(p-クロロフェニル) アクリロフェノン0.5g (1.80mmol)、ニコチンヒドラジド0.49g (3.57mmol)、アセトニトリル8mlの混合物を50℃下5日間攪拌した。濃縮後、残留物をジエチルエーテル40mlに溶かし、水20mlで2回洗浄した。無水硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮し0.26gの4'-クロロ-2-(p-クロロフェニル)-3-(2-ニコチンイルヒドラジノ) プロピオ

53

エノン (参-7) を無色アモルファスとして得た。

【0166】¹H-NMR(CDC1₃): 3.31(1H, dd, J=12.7, 5.1Hz), 3.78(1H, dd, J=12.7, 8.7Hz), 4.80(1H, d, J=8.7, 5.1Hz), 7.12-7.41(7H, m), 7.69-7.75(1H, m), 7.78-7.87(2H, m), 7.99-8.04(1H, m), 8.73(1H, br. d), 8.91(1H, s).

【参考例5】4'-クロロ-2-(p-クロロフェニル)アクリロニトリル0.5g (1.80mmol)、4-アミノ-1,2,4-トリアゾール0.3g (3.57mmol)、メタノール8mlの混合物を50℃で5日間攪拌した。濃縮後、残留物をジエチルエーテル30mlに溶かし、水15mlで3回洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。このエーテル溶液を一晩放置し、析出した無色結晶をろ取し、0.43gの4'-クロロ-2-(p-クロロフェニル)-3-(1,2,4-トリアゾール-4-イルアミノ)プロピオフェノン (参-8) を得た。Mp. 106-107℃。

【0167】¹H-NMR(DMSO-d₆): 3.33-3.41(1H, m), 3.76-3.89(1H, m), 4.98(1H, dd, J=7.8, 5.9Hz), 6.84(1H, t, J=5.0Hz), 7.37(4H, s), 7.52-7.57(2H, m), 7.98-8.04(2H, m), 8.48(2H, s).

【参考例6】4'-クロロ-2-(p-クロロフェニル)アクリロフェノン0.5g (1.80mmol)、p-クロロベンゾヒドラジド0.61g (3.58mmol)、メタノール10mlの混合物を50℃で5時間攪拌した。濃縮後、ジエチルエーテルを加えて不溶物をろ過し、ろ液を濃縮してカラムクロマトグラフィー (展開溶媒: ヘキサン/酢酸エチル=2/1) で精製し、0.73gの4'-クロロ-3-[2-(p-クロロベンゾイル)ヒドラジノ]-2-(p-クロロフェニル)プロピオフェノン (参-9) を無色固体として得た。Mp. 52-54℃。

【0168】¹H-NMR(CDC1₃): 3.27(1H, dd, J=12.7, 5.1Hz), 3.75(1H, dd, J=12.7, 8.7Hz), 4.77(1H, d, J=8.7, 5.1Hz), 3.65(1H, br. s), 7.18-7.38(8H, m), 7.55-7.61(2H, m), 7.80-7.87(2H, m), 7.95(1H, br. s).

同様に4'-クロロ-2-(p-クロロフェニル)-3-[2-(p-ニトロベンゾイル)ヒドラジノ]プロピオフェノン (参-10) を黄色固体として得た。Mp. 65-68℃。

【0169】¹H-NMR(CDC1₃): 3.32(1H, dd, J=12.7, 5.1Hz), 3.77(1H, dd, J=12.7, 8.6Hz), 4.78(1H, d, J=8.6, 5.1Hz), 7.20-7.38(6H, m), 7.79-7.90(5H, m), 8.23-8.30(2H, m).

【参考例7】4'-クロロ-2-(p-クロロフェニル)アクリロフェノン0.5g (1.80mmol)、メタノール10mlの混合物にフェノキシアセトヒドラジド0.6g (3.61mmol) を加え室温下24時間攪拌した。濃縮後、残留物をカラムクロマトグラフィー (展開溶媒: クロロホルム/酢酸エチル=7/1) で精製し、

54

0.72gの4'-クロロ-2-(p-クロロフェニル)-3-[2-(フェノキシアセチル)ヒドラジノ]プロピオフェノン (参-11) を無色固体として得た。Mp. 115-116℃。

【0170】¹H-NMR(CDC1₃): 3.18(1H, dd, J=12.7, 5.3Hz), 3.60(1H, br. s), 3.71(1H, dd, J=12.7, 8.7Hz), 4.48(2H, d, J=15.0Hz), 4.68(1H, dd, J=8.7, 5.3Hz), 6.84-6.92(2H, m), 7.00-7.10(1H, m), 7.14-7.38(8H, m), 7.78-7.85(2H, m), 7.87(1H, br. s).

同様に4'-クロロ-2-(p-クロロフェニル)-3-[2-(メトキシアセチル)ヒドラジノ]プロピオフェノン (参-12)、4'-クロロ-2-(p-クロロフェニル)-3-[2-(エトキシカルボニル)ヒドラジノ]プロピオフェノン (参-13)、4'-クロロ-2-(p-クロロフェニル)-3-[2-(N,N-ジメチルカルバモイル)ヒドラジノ]プロピオフェノン (参-14)、4'-クロロ-2-(p-クロロフェニル)-3-[2-(2-(ヒドロキシメチル)ベンゾイル)ヒドラジノ]プロピオフェノン (参-15)、4'-クロロ-2-(p-クロロフェニル)-3-[2-(プロボキシカルボニル)ヒドラジノ]プロピオフェノン (参-16)、4'-クロロ-2-(p-クロロフェニル)-3-[2-(イソプロボキシカルボニル)ヒドラジノ]プロピオフェノン (参-17)、4'-クロロ-2-(p-クロロフェニル)-3-[2-(2,2-トリフルオロエトキシカルボニル)ヒドラジノ]プロピオフェノン (参-18)、4'-クロロ-2-(p-クロロフェニル)-3-[2-(N-エチルカルバモイル)ヒドラジノ]プロピオフェノン (参-19)、4'-クロロ-2-(p-クロロフェニル)-3-[2-(N-メチルチオカルバモイル)ヒドラジノ]プロピオフェノン (参-20)、4'-クロロ-2-(p-クロロフェニル)-3-[2-(N-エチルチオカルバモイル)ヒドラジノ]プロピオフェノン (参-21)、4'-クロロ-2-(p-クロロフェニル)-3-[2-(N-フェニルチオカルバモイル)ヒドラジノ]プロピオフェノン (参-22)、4'-クロロ-2-(p-クロロフェニル)-3-[2-(N-(p-クロロフェニル)チオカルバモイル)ヒドラジノ]プロピオフェノン (参-23) を得た。

【0171】参-12 (無色油状物)

¹H-NMR(CDC1₃): 3.17(1H, dd, J=12.7, 5.4Hz), 3.37(3H, s), 3.68(1H, J=12.7, 8.5Hz), 3.85(1H, d, J=15.1Hz), 3.90(1H, d, J=15.1Hz), 4.72(1H, dd, J=8.5, 5.4Hz), 7.18-7.39(6H, m), 7.80-7.89(2H, m).

参-13 (Mp. 82-83℃)

¹H-NMR(CDC1₃): 1.21(3H, t, J=7.1Hz), 3.18(1H, dd, J=12.4, 5.5Hz), 3.10(1H, br. s), 3.67(1H, dd, J=12.4, 8.6Hz), 4.09(2H, d, J=7.1Hz), 4.76(1H, dd, J=8.6, 5.5Hz), 6.23(1H, s), 7.17-7.39(6H, m), 7.82-7.89(2

H, m).

参-14 (無色アモルファス)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$: 2.80(6H, s), 2.75(1H, br. s), 3.16(1H, dd, $J=12.4$, 5.4Hz), 3.65(1H, dd, $J=12.4$, 8.5 Hz), 4.76(1H, dd, $J=8.5$, 5.4Hz), 5.86(1H, s), 7.24-7.29(4H, m), 7.33-7.40(2H, m), 7.84-7.92(2H, m).

参-15 (無色アモルファス)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$: 3.23(1H, dd, $J=12.7$, 5.2Hz), 3.75(1H, dd, $J=12.7$, 8.7Hz), 3.70(2H, br. s), 4.53(2 H, s), 4.80(1H, dd, $J=8.7$, 5.2Hz), 7.18-7.49(10H, m), 7.80-7.88(2H, m), 8.27(1H, s).

参-16 (無色アモルファス)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$: 0.90(3H, t, $J=7.4$ Hz), 1.59(2 H, 6重, $J=7.4$ Hz), 3.17(1H, dd, $J=12.4$, 5.5Hz), 3.47(1 H, br), 3.67(1H, dd, $J=12.4$, 8.5Hz), 3.90-4.08(2H, m), 4.76(1H, dd, $J=8.5$, 5.5Hz), 6.28(1H, br), 7.18-7.44(6 H, m), 7.80-7.93(2H, m).

参-17 (無色アモルファス)

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$: 1.20(6H, t, $J=6.0$ Hz), 3.17(1 H, dd, $J=12.4$, 5.5Hz), 3.67(1H, dd, $J=12.4$, 8.5Hz), 4.12(1H, br), 4.76(1H, dd, $J=8.5$, 5.5Hz), 4.87(1H, 7重, $J=6.0$ Hz), 6.24(1H, s), 7.18-7.40(6H, m), 7.83-7.92(2 H, m).

参-18 (Mp. 94-96°C)

参-19 (Mp. 111-113°C)

参-20 (Mp. 77-79°C)

参-21 (Mp. 95-99°C)

参-22 (Mp. 147-148°C)

参-23 (Mp. 152.5-154°C)

【参考例8】4'-クロロ-2-(p-クロロフェニル)アクリロフェノン1g (3.61mmol)、カルバジン酸フェニル1.1g (7.23mmol)、アセトニトリル20mlの混合物を50°Cで1週間攪拌した。濃縮後、残留物をカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサン/酢酸エチル=2/1)で精製し、0.94gの4'-クロロ-2-(p-クロロフェニル)-3-[2-(フェノキシカルボニル)ヒドラジノ]プロピオフェノン(参-24)を無色固体として得た。Mp. 45-46°C.

【0172】 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$: 3.28(1H, dd, $J=12.4$, 5.6Hz), 3.49(1H, br. s), 3.75(1H, dd, $J=12.4$, 8.4 Hz), 4.80(1H, dd, $J=8.4$, 5.6Hz), 6.66(1H, br. s), 7.00-7.08(2H, m), 7.15-7.38(9H, m), 7.82-7.89(2H, m).

【参考例9】4, 4'-ジクロロカルコン0.5g (1.80mmol)、アセトヒドラジド0.27g (3.64mmol)、アセトニトリル8ml、エタノール8mlの混合物を50°Cで1週間攪拌した。濃縮後、残留物をカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサン/アセトン=2/1)で精製し、0.35gの3-(2-アセチルヒドラジノ)-4'-クロロ-3-(p-クロロフェニル)プロピオフェノン(参-25)を無色油状物として得た。

【0173】 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$: 1.80(3H, s), 3.26(1H, dd, $J=17.2$, 6.1Hz), 3.42(1H, dd, $J=17.2$, 7.0Hz), 4.68(1H, t, $J=6.4$ Hz), 7.20-7.42(6H, m), 7.73-7.81(2H, m), 8.27(1H, s).

【参考例10】4'-クロロ-2-(p-クロロフェニル)アクリロフェノン0.5g (1.80mmol)、アセトニトリル10mlの混合物にカルバジン酸n-プロピル0.64g (3.85mmol)を加え、室温下4日間攪拌した。濃縮後、ジエチルエーテル30mlに溶かし、2回水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮し、カラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサン/酢酸エチル=1/1)で精製し、0.36gの4'-クロロ-2-(p-クロロフェニル)-3-[2-(プロポキシカルボニル)ヒドラジノ]プロピオフェノンプロポキシカルボニルヒドラゾン(参-26)を無色油状物として得た。

【0174】 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$: 0.93(6 H, t, $J=7.4$ Hz), 1.55-1.77(4 H, m), 3.26(1H, dd, $J=12.3$, 5.9Hz), 3.50(1H, br. s), 3.52(1H, dd, $J=12.3$, 9.2Hz), 4.02-4.15(5H, m), 6.47(1H, s), 6.83-6.89(2H, m), 7.04-7.11(1H, m), 7.20-7.37(5 H, m), 7.56(1H, s).

【参考例11】4'-クロロ-2-(p-クロロフェニル)アクリロフェノン1g (3.61mmol)、メチルチオアセトヒドラジド0.65g (5.41mmol)、エタノール8mlの混合物を50°Cで3時間、室温下15時間攪拌した。濃縮後、ジエチルエーテル30mlに溶かし、水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させた。濃縮後、カラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサン/アセトン=3/1)で精製し、1.0gの4'-クロロ-2-(p-クロロフェニル)-3-[2-(メチルチオアセチル)ヒドラジノ]プロピオフェノン(参-27)を無色アモルファスとして得た。

【0175】 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$: 2.12(3H, s), 3.10-3.25(3H, m), 3.67(1H, br. t), 4.73(1H, dd, $J=8.6$, 5.3Hz), 4.76(1H, br. s), 7.18-7.42(6H, m), 7.81-7.91(2 H, m), 8.18(1H, s).

同様に、4'-クロロ-2-(p-クロロフェニル)-3-(2-プロピオニルヒドラジノ)プロピオフェノン(参-28)、4'-クロロ-2-(p-クロロフェニル)-3-(2-ブチルヒドラジノ)プロピオフェノン(参-29)、4'-クロロ-2-(p-クロロフェニル)-3-(2-イソブチルヒドラジノ)プロピオフェノン(参-30)、4'-クロロ-2-(p-クロロフェニル)-3-(2-バレリルヒドラジノ)

57

プロピオフェノン (参-31) を得た。

【0176】参-28 (無色油状物)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): 1.09 (3H, t, $J=7.6\text{Hz}$), 2.10 (2H, q, $J=7.6\text{Hz}$), 3.15 (1H, dd, $J=12.6, 5.3\text{Hz}$), 3.64 (1H, dd, $J=12.6, 8.6\text{Hz}$), 4.71 (1H, dd, $J=8.6, 5.3\text{Hz}$), 7.15-7.45 (7H, m), 7.80-7.91 (2H, m).

参-29 (無色油状物)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): 0.91 (3H, t, $J=7.4\text{Hz}$), 1.60 (2H, 6重, $J=7.4\text{Hz}$), 2.04 (2H, t, $J=7.4\text{Hz}$), 3.14 (1H, dd, $J=12.5, 5.2\text{Hz}$), 3.64 (1H, dd, $J=12.5, 8.7\text{Hz}$), 4.71 (1H, dd, $J=8.7, 5.2\text{Hz}$), 7.15-7.44 (7H, m), 7.80-7.91 (2H, m).

参-30 (無色油状物)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): 1.07 (3H, d, $J=6.9\text{Hz}$), 1.11 (3H, d, $J=6.9\text{Hz}$), 2.26 (1H, 7重, $J=6.9\text{Hz}$), 3.15 (1H, dd, $J=12.5, 5.3\text{Hz}$), 3.63 (1H, dd, $J=12.5, 8.5\text{Hz}$), 4.70 (1H, dd, $J=8.5, 5.3\text{Hz}$), 7.15-7.40 (7H, m), 7.80-7.90 (2H, m).

参-31 (無色油状物)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): 0.88 (3H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 1.15-1.62 (4H, m), 2.06 (2H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 3.13 (1H, dd, $J=12.5, 5.1\text{Hz}$), 3.64 (1H, dd, $J=12.5, 8.7\text{Hz}$), 4.72 (1H, dd, $J=8.7, 5.1\text{Hz}$), 7.14-7.40 (6H, m), 7.47 (1H, s), 7.79-7.91 (2H, m).

【参考例12】4'-クロロ-2-(p-クロロフェニル) アクリロフェノン 1.39 g (5.0 mmol)、チオセミカルバジド 0.91 g (10.0 mmol)、DMSO 15 ml の混合物を室温で15時間攪拌した後、水50 ml にあけた。混合物をクロロホルムで三回抽出し、有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥させた。濃縮後、カラムクロマトグラフィー (展開溶媒: ジクロロメタン/メタノール=20/1) で精製し、1.39 g の1-[2, 3-ビス(p-クロロフェニル)-3-オキソプロピル] チオセミカルバジド (参-32) を無色アモルファスとして得た。

【0177】 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): 3.17 (1H, dd, $J=12.3, 5.3\text{Hz}$), 3.58 (1H, dd, $J=12.3, 8.5\text{Hz}$), 4.33 (1H, br s), 4.80 (1H, dd, $J=8.5, 5.3\text{Hz}$), 6.53 (1H, br s), 6.93 (1H, brs), 7.12-7.41 (6H, m), 7.78-7.92 (2H, m), 8.55 (1H, s).

【参考例13】4'-クロロ-2-(p-クロロフェニル) アクリロフェノン 1.39 g (5.0 mmol)、4-(p-クロロフェニル) セミカルバジド 1.11 g (6.0 mmol)、DMSO 10 ml の混合物を室温で5日間攪拌した後、水50 ml にあけた。生じた固体をアセトニトリルで洗浄し、1.68 g の1-[2, 3-ビス(p-クロロフェニル)-3-オキソプロピル]-4-(p-クロロフェニル) セミカルバジド (参-33) を

58

得た。Mp. 169-171°C.

【0178】 $^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$): 2.97-3.11 (1H, m), 3.44-3.61 (1H, m), 4.95-5.15 (2H, m), 7.13-7.23 (2H, m), 7.27-7.40 (6H, m), 7.42-7.51 (2H, m), 7.85 (1H, s), 7.94-8.08 (2H, m), 8.32 (1H, s).

【参考例14】4'-クロロ-2-(p-クロロフェニル) アクリロフェノン 1 g (3.61 mmol)、2-メチルカルバジン酸エチル 0.64 g (5.42 mmol)、エタノール 15 ml の混合物を60°Cで30時間攪拌した。濃縮後、カラムクロマトグラフィー (展開溶媒: ヘキサン/酢酸エチル=2/1) で精製し、0.69 g の4'-クロロ-2-(p-クロロフェニル)-3-(2-エトキシカルボニル-2-メチルヒドラジノ) プロピオフェノン (参-34) を黄色油状物として得た。

【0179】 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): 1.17 (3H, t, $J=7.1\text{Hz}$), 2.99 (3H, s), 3.14 (1H, dd, $J=12.2, 5.2\text{Hz}$), 3.68 (1H, dd, $J=12.2, 8.7\text{Hz}$), 3.91-4.15 (2H, m), 4.66 (1H, br s), 4.70 (1H, dd, $J=8.7, 5.2\text{Hz}$), 7.19-7.40 (6H, m), 7.83-7.91 (2H, m).

20 【参考例15】窒素気流中、2, 3-ビス(p-クロロフェニル) プロピオンニトリル 10 g (36.21 mmol) のジクロロメタン溶液 (100 ml) に氷冷下で水素化ジイソブチルアルミニウムトルエン溶液 40 ml (1 M, 40 mmol) を40分間で滴下した。室温で4時間攪拌後、飽和塩化アンモニウム水溶液 20 ml を氷冷下で滴下し、室温で1時間攪拌した。10%希硫酸 40 ml を加えて30分攪拌後、ジクロロメタンで抽出した。有機層を水及び重曹水で洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥させた。濃縮後、9.29 g の2, 3-ビス(p-クロロフェニル) プロピオンアルデヒドを黄色油状物として得た。

30 【0180】2, 3-ビス(p-クロロフェニル) プロピオンアルデヒド 1.84 g (6.59 mmol)、N, N-ジメチルヒドラジン 0.55 ml (7.24 mmol)、エタノール 10 ml の混合溶液を30分間攪拌した。濃縮後、ジエチルエーテル 35 ml に溶かし、水洗した。無水硫酸ナトリウムで乾燥させた後、濃縮残渣をカラムクロマトグラフィー (展開溶媒: ヘキサン/酢酸エチル=6/1) で精製し、1.74 g の2, 3-ビス(p-クロロフェニル) プロピオンアルデヒド ジメチルヒドラゾンを淡黄色油状物として得た。

40 【0181】2, 3-ビス(p-クロロフェニル) プロピオンアルデヒド ジメチルヒドラゾン 1.40 g (4.36 mmol)、水素化シアノホウ素ナトリウム 0.30 g (4.77 mmol)、エタノール 5 ml の混合物に4 M 塩化水素ジオキサン溶液 3.5 ml を1時間で滴下した。室温下3時間攪拌後、水 20 ml を加え、水酸化ナトリウム (0.56 g) でアルカリ性とした。ジエチルエーテルで2回抽出し、有機層を水洗、乾燥 (無水硫酸マグネシウム) した。濃縮後、カラムクロマトグラフィー (展開溶媒: クロロホルム/アセトン=7/1) で精製

し、0.75gの2-[2,3-ビス(p-クロロフェニル)プロピル]-1,1-ジメチルヒドラジン(参-35)を無色油状物として得た。

【0182】¹H-NMR(CDC1₃): 2.35(6H, s), 2.64-3.14(5H, m), 6.86-7.30(8H, m).

同様に、N'-[2,3-ビス(p-クロロフェニル)プロピル]アセトヒドラジド(参-36)、3-2,3-ビス(p-クロロフェニル)プロピルカルバジン酸エチル(参-37)、3-2,3-ビス(p-クロロフェニル)プロピルカルバジン酸t-ブチル(参-38)を得た。

【0183】参-36 (Mp. 148-149℃)

参-37 (無色油状物)

¹H-NMR(CDC1₃): 1.23(3H, t, J=7.1Hz), 2.66-2.85(1H, m), 2.89-3.31(4H, m), 4.12(2H, q, J=7.1Hz), 6.08(1H, s), 6.83-7.32(8H, m).

参-38 (無色油状物)

¹H-NMR(CDC1₃): 1.43(9H, s), 2.74(1H, dd, J=15.1, 10.0Hz), 2.90-3.28(4H, m), 3.80(1H, br), 5.92(1H, s), 6.86-7.28(8H, m).

【参考例16】m-クロロベンズアルデヒド10.01g(0.0712mol)、ヨウ化亜鉛0.20g(0.71mmol)、ジクロロメタン10mlの混合物に、5℃でトリメチルシリルニトリル10.45ml(0.0783mmol)の5mlジクロロメタン溶液を30分間で滴下した。室温で6時間攪拌後、濃縮、減圧蒸留により、15.47gの2-(m-クロロフェニル)-2-(トリメチルシロキシ)アセトニトリルを得た。Bp. 98-100℃/2mmHg.

【0184】窒素気流中、2-(m-クロロフェニル)-2-(トリメチルシロキシ)アセトニトリル2.0g(8.34mmol)のTHF30ml溶液に、-65℃でブチルリチウムヘキサン溶液5.5ml(1.6M, 8.76mmol)を滴下した。同温度で30分間攪拌した後、塩化p-クロロベンジル0.94g(5.84mmol)のTHF10ml溶液を滴下した。1時間かけて-30℃まで昇温した後、反応混合物にメタノール5ml、水2ml、フッ化カリウム(1.5g)水溶液(5ml)をこの順に加え、5分間攪拌した。反応混合物をクロロホルムで三回抽出し、抽出液を乾燥(無水硫酸マグネシウム)した。濃縮後、カラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサン/酢酸エチル=5/1)で精製し、1.24gの3,4'-ジクロロデオキシベンゾインを得た。

【0185】3,4'-ジクロロデオキシベンゾイン1.24g(4.68mmol)、3%ホルムアルデヒド水溶液1.4ml(23.4mmol)、ピペリジン0.05ml、酢酸0.05ml、メタノール20mlの混合物を室温で3日間攪拌した。反応混合物に水を加えてクロロホルムで三回抽出した。抽出液を乾燥(無水硫酸マグネシウム)後、濃縮し、1.34gの3'-クロロ-2-(p

-クロロフェニル)アクリロフェノン(参-39)を淡黄色油状物として得た。

【0186】¹H-NMR(CDC1₃): 5.70(1H, s), 6.12(1H, s), 7.34-7.42(5H, m), 7.52-7.57(1H, m), 7.70-7.76(1H, m), 7.85-7.87(2H, m).

同様に、m-クロロベンズアルデヒドの代わりに6-クロロニコチンアルデヒドを用いて1-(6-クロロ-3-ピリジル)-2-(p-クロロフェニル)プロベノン(参-40)、m-クロロベンズアルデヒドの代わりにp-クロロベンズアルデヒドを、塩化p-クロロベンジルの代わりに2-クロロ-5-(クロロメチル)チアゾールを用いて4'-クロロ-2-(2-クロロ-5-チアゾリル)アクリロフェノン(参-41)、m-クロロベンズアルデヒドの代わりにp-クロロベンズアルデヒドを、塩化p-クロロベンジルの代わりに5-クロロ-2-(クロロメチル)ピリジンを用いて4'-クロロ-2-(5-クロロ-2-ピリジル)アクリロフェノン(参-42)、m-クロロベンズアルデヒドの代わりにp-クロロベンズアルデヒドを、塩化p-クロロベンジルの代わりに2-クロロ-5-(クロロメチル)ピリジンを用いて4'-クロロ-2-(6-クロロ-3-ピリジル)アクリロフェノン(参-43)、塩化p-クロロベンジルの代わりに2-クロロ-5-(クロロメチル)ピリジンを用いて3'-クロロ-2-(6-クロロ-3-ピリジル)アクリロフェノン(参-44)、m-クロロベンズアルデヒドの代わりにp-クロロベンズアルデヒドを、塩化p-クロロベンジルの代わりに3-ブロモ-8-(クロロメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジンを用いて4'-クロロ-2-(3-ブロモイミダゾ[1,2-a]ピリジン-8-イル)アクリロフェノン(参-45)を得た。

【0187】参-40 (褐色結晶)

¹H-NMR(CDC1₃): 5.78(1H, s), 6.17(1H, s), 7.35(4H, s), 7.43(1H, dd, J=8.4, 0.8Hz), 8.12(1H, dd, J=8.4, 2.6Hz), 8.80(1H, dd, J=2.6, 0.8Hz).

参-41 (精製せず)

参-42 (淡褐色アモルファス)

¹H-NMR(CDC1₃): 5.82(1H, s), 6.60(1H, s), 7.40-7.50(3H, m), 7.66(1H, dd, J=8.4, 2.4Hz), 7.87-7.83(2H, m), 8.53(1H, d, J=2.4Hz).

参-43 (淡褐色結晶)

参-44 (白色結晶)

¹H-NMR(CDC1₃): 5.89(1H, s), 6.28(1H, s), 7.32-7.46(2H, m), 7.55-7.60(1H, m), 7.70-7.85(3H, m), 8.47-8.49(1H, m).

参-45 (白色結晶)

¹H-NMR(CDC1₃): 6.02(1H, s), 6.82(1H, s), 6.94(1H, t, J=7.0Hz), 7.24-7.29(1H, m), 7.37-7.44(2H, m), 7.60(1H,

61

s), 7.89-7.96 (2H, m), 8.10-8.14 (1H, m).

〔参考例17〕4'-クロロ-3-(p-クロロフェニル)プロピオフェノン1.27g (4.55mmol)、37%ホルムアルデヒド水溶液3.4ml (45.5mmol)、ピペリジン0.2ml、酢酸0.2ml、メタノール10mlの混合物を、ステンレス製耐圧反応容器中、120℃で20時間撹拌した。反応混合物に水を加えてクロロホルムで三回抽出した。抽出液を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、濃縮残渣をカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:クロロホルム/ヘキサン=1/1)で精製し、0.60gの4'-クロロ-2-(p-クロロベンジル)アクリロフェノン(参-46)を白色結晶として得た。

〔0188〕¹H-NMR(CDC1₃): 3.75(2H, s), 5.67(1H, d, J=0.4Hz), 5.78(1H, d, J=0.4Hz), 7.15-7.29(4H, m), 7.36-7.43(2H, m), 7.61-7.68(2H, m).

〔参考例18〕臭化p-クロロフェナシル1.0g (4.28mmol)、p-クロロフェノール0.83g (6.42mmol)、炭酸カリウム0.83g (6.0mmol)、トルエン2mlの混合物を100℃で1時間撹拌した。反応混合物にクロロホルム20mlを加えて不溶物をろ別し、ろ液を2N水酸化ナトリウム水溶液で洗浄した。無水硫酸マグネシウムで乾燥後、濃縮残渣にジイソプロピルエーテルを加えて、結晶をろ取した。0.89gの4'-クロロ-2-(p-クロロフェノキシ)アセトフェノンを白色結晶として得た。

〔0189〕¹H-NMR(CDC1₃): 5.20(2H, s), 6.82-6.90(2H, m), 7.20-7.28(2H, m), 7.44-7.51(2H, m), 7.90-7.97(2H, m).

4'-クロロ-2-(p-クロロフェノキシ)アセトフェノン0.89g (3.17mmol)、37%ホルムアルデヒド水溶液1.2ml (15.9mmol)、ピペリジン0.04ml、酢酸0.04ml、メタノール10mlの混合物を室温で3日間撹拌した。反応混合物に水30mlを加えてクロロホルムで三回抽出した。抽出液を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、濃縮残渣をカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサン/酢酸エチル=7/1)で精製し、0.87gの粗製の4'-クロロ-2-(p-クロロフェノキシ)アクリロフェノン(参-47)を得た。

〔0190〕〔参考例19〕臭化p-クロロフェナシル3.0g (0.0129mol)、チオフェノール1.45ml (0.0141mol)、水酸化ナトリウム0.56g (0.0141mol)、水1.3ml、ジクロロメタン5mlの混合物を室温で2時間撹拌した。反応混合物に水を加えてジエチルエーテルで抽出した。エーテル層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、濃縮した。3.10gの4'-クロロ-2-(フェニルチオ)アセトフェノンを白色結晶として得た。

62

〔0191〕¹H-NMR(CDC1₃): 4.20(2H, s), 7.22-7.46(7H, m), 7.84-7.90(2H, m).

4'-クロロ-2-(フェニルチオ)アセトフェノン1.0g (3.81mmol)、37%ホルムアルデヒド水溶液1.4ml (19.05mmol)、ピペリジン0.1ml、酢酸0.1ml、ジクロロメタン10mlの混合物を室温で15時間撹拌した。反応混合物に水30mlを加えてクロロホルムで三回抽出した。抽出液を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、濃縮し、1.13gの4'-クロロ-2-(フェニルチオ)アクリロフェノン(参-48)を黄色油状物として得た。

〔0192〕¹H-NMR(CDC1₃): 5.59(1H, d, J=1.0Hz), 5.81(1H, d, J=1.0Hz), 7.24-7.51(7H, m), 7.71-7.76(2H, m).

〔参考例20〕4'-クロロ-2-(p-クロロアニリノ)アセトフェノン1.35g (4.82mmol)、クロロ炭酸メチル0.61ml (7.71mmol)、炭酸カリウム1.07g (7.71mmol)、アセトニトリル20mlの混合物を7時間加熱還流した。反応混合物に水30mlを加えてクロロホルムで三回抽出した。抽出液を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、濃縮し、1.62gのN-(p-クロロフェナシル)-N-(p-クロロフェニル)カルバミン酸メチルを淡黄色結晶として得た。

〔0193〕N-(p-クロロフェナシル)-N-(p-クロロフェニル)カルバミン酸メチル0.80g (2.37mmol)、37%ホルムアルデヒド水溶液2.7ml (35.6mmol)、ピペリジン0.04ml、酢酸0.04ml、メタノール20mlの混合物を、ステンレス製耐圧反応容器中、120℃で3時間撹拌した。反応混合物に水を加えてクロロホルムで三回抽出した。抽出液を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、濃縮残渣をカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサン/酢酸エチル=4/1)で精製し、0.66gの4'-クロロ-2-(p-クロロ-N-メトキシカルボニルアニリノ)アクリロフェノン(参-49)を淡黄色油状物として得た。

〔0194〕¹H-NMR(CDC1₃): 3.65(3H, s), 5.32(1H, s), 5.33(1H, s), 7.26-7.49(6H, m), 7.92-7.96(2H, m).

〔実施例1〕4'-クロロ-2-(p-クロロフェニル)-3-(2,2-ジメチルヒドラジノ)プロピオフェノン(参-1)1.15g (3.41mmol)、ジエチルエーテル8mlの混合物に室温下、p-クロロフェニルイソシアナート0.61g (3.97mmol)を加え、一晚撹拌させた。濃縮後、カラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサン/酢酸エチル=6/1)で精製し、1.13gの4-(p-クロロフェニル)-2-[2,3-ビス(p-クロロフェニル)-3-オキソプロピル]-1,1-ジメチルセミカルバジド(No.147)を無色固体として得た。Mp. 61-63℃。

〔0195〕¹H-NMR(CDC1₃): 1.93(3H, s), 2.

46(3H, s), 3.51(1H, dd, $J=13.6, 8.2\text{Hz}$), 3.92(1H, dd, $J=13.6, 5.9\text{Hz}$), 5.56(1H, dd, $J=8.2, 5.9\text{Hz}$), 7.24-7.45(10H, m), 7.85-7.91(2H, m), 8.60(1H, s).

同様にして以下の化合物を得た。前記参考例で製造した化合物(参-1~参-49)を原料として使用した場合は()内に記した。それ以外の原料は全て既知化合物で、生成物の構造(表4以降参照)より容易に特定できる。以下の実施例でも同様。

【0196】No. 150(参-1)、No. 152(参-1)、No. 749(参-1)、No. 158(参-2)、No. 248(参-5)、No. 186(参-12)、No. 745(参-13)、No. 746(参-13)、No. 755(参-13)、No. 251(参-16)、No. 277(参-34)、No. 278(参-34)、No. 848(参-35)、No. 849(参-35)、No. 845(参-37)、No. 846(参-37)。

【0197】〔実施例2〕4'-クロロ-2-(p-クロロフェニル)-3-[2-(メトキシカルボニル)ヒドラジノ]プロピオフェノン(参-3) 0.63g (1.72mmol)、ジエチルエーテル10mlの混合物にp-クロロフェニルイソシアナート0.3g (1.95mmol)を加え、室温下15時間攪拌した。析出した固体をろ取し、乾燥させて0.5gの4-(p-クロロフェニル)-2-[2,3-ビス(p-クロロフェニル)-3-オキソプロピル]-1-(メトキシカルボニル)セミカルバジド(No. 204)を無色固体として得た。Mp. 162-164℃。

【0198】 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$: 3.60(3H, s), 3.85-4.20(2H, br.), 5.13(1H, br. t), 7.24-7.40(6H, m), 7.46-7.58(4H, m), 7.92-8.03(2H, m), 8.90(1H, s), 9.37(1H, s)。

元素分析値 ($\text{C}_{24}\text{H}_{20}\text{Cl}_2\text{N}_2\text{O}_4$)

計算値 C:55.35, H:3.87, N:8.07

実測値 C:55.16, H:3.90, N:8.16

同様にして以下の化合物を得た。

【0199】No. 160(参-4)、No. 197(参-6)、No. 202(参-7)、No. 203(参-8)、No. 198(参-9)、No. 199(参-10)、No. 196(参-11)、No. 185(参-12)、No. 187(参-12)、No. 210(参-13)、No. 211(参-13)、No. 212(参-13)、No. 213(参-13)、No. 214(参-13)、No. 215(参-13)、No. 216(参-13)、No. 217(参-13)、No. 219(参-13)、No. 222(参-13)、No. 264(参-14)、No. 200(参-15)、No. 239(参-16)、No. 241(参-17)、No. 254(参-18)、No. 255(参-18)、No. 804(参-25)、No. 190(参-27)、No. 191(参-27)、No. 166(参-28)、No. 167(参-28)、No. 171(参-2

9)、No. 173(参-29)、No. 178(参-30)、No. 179(参-30)、No. 180(参-31)、No. 181(参-31)、No. 847(参-38)。

【0200】〔実施例3〕2-フェニルアクリロフェノン0.5g (2.40mmol)、エタノール5mlの混合物にアセトヒドラジド265mg (3.60mmol)を加え室温下15時間攪拌した。析出晶をろ過し、粗中間体を得た。これをジエチルエーテル10mlに溶解し、p-クロロフェニルイソシアナート400mg (2.64mmol)を加え室温下15時間攪拌した。析出晶をろ過して、1.0gの1-アセチル-4-(p-クロロフェニル)-2-(2,3-ジフェニル-3-オキソプロピル)セミカルバジド(No. 2)を白色固体として得た。Mp. 168-169℃。

【0201】 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$: 1.59(3H, s), 3.80-3.95(1H, m), 4.10-4.20(1H, m), 5.20-5.35(1H, m), 7.12-7.49(13H, m), 7.62(1H, s), 7.93-7.96(2H, m)。

同様にしてNo. 3、No. 4及びNo. 5を得た。

【0202】〔実施例4〕2-フェニルアクリロフェノン0.5g (2.40mmol)、エタノール5mlの混合物にN,N-ジメチルヒドラジン0.55ml (3.60mmol)を加え室温下15時間攪拌した。反応混合物を濃縮し、残留物にジエチルエーテル5ml、p-クロロフェニルイソシアナート0.44g (2.87mmol)を加え室温下15時間攪拌した。不溶物をろ過し、ろ液を濃縮し、カラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサン/酢酸エチル=4/1)で精製し、0.28gの4-(p-クロロフェニル)-1,1-ジメチル-2-(2,3-ジフェニル-3-オキソプロピル)セミカルバジド(No. 6)を無色油状物として得た。

【0203】 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$: 1.86(3H, s), 2.45(3H, s), 3.56(1H, dd, $J=13.8, 8.2\text{Hz}$), 3.96(1H, dd, $J=13.8, 5.8\text{Hz}$), 5.61(1H, dd, $J=8.2, 5.8\text{Hz}$), 7.13-7.47(12H, m), 7.94-7.99(2H, m), 8.63(1H, s)。

同様にして以下の化合物を得た。

【0204】No. 7、No. 25、No. 29、No. 361、No. 362、No. 403、No. 404、No. 407、No. 408、No. 436、No. 437、No. 441、No. 442、No. 464、No. 465、No. 498(参-39)、No. 499(参-39)。

【0205】〔実施例5〕4'-クロロ-2-(p-クロロフェニル)アクリロフェノン2.0g (7.22mmol)、ジエチルエーテル20mlの混合物にN-ベンジル-N-メチルヒドラジン1.5g (11.01mmol)を加え室温下15時間攪拌した。反応混合物にp-クロロフェニルイソシアナート1.70g (11.07mmol)を加え室温下15時間攪拌した。反応混合物を濃縮し、カラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサン/アセトン=6/1)で精製し、2.96gの1-ベンジル-

65

4-(p-クロロフェニル)-1-メチル-2-[2, 3-ビス(p-クロロフェニル)-3-オキソプロピル]セミカルバジド (No. 155) を淡黄色アモルファスとして得た。

【0206】IR(CHCl₃): 3350, 1675, 1585, 1510 cm⁻¹

【実施例6】1-[2, 3-ビス(p-クロロフェニル)-3-オキソプロピル]-4-(p-クロロフェニル)セミカルバジド (参-33) 0.46 g (1.0 mmol) の5 ml DMF溶液にp-(トリフルオロメチル)フェニルイソシアナート0.21 g (1.1 mmol) を加え、室温で2時間攪拌した。反応混合物を水50 mlにあげ、生成した固体をろ取した。この固体をアセトニトリルから再結晶することにより、0.39 gの1-[2, 3-ビス(p-クロロフェニル)-3-オキソプロピル]-4-(p-クロロフェニル)-1-[p-(トリフルオロメチル)フェニルカルバモイル]セミカルバジド (No. 263) を得た。Mp. 195-200℃。

【0207】¹H-NMR(DMSO-d₆): 3.80-4.40 (2H, m), 5.26(1H, t, J=6.3 Hz), 7.13-7.62(12H, m), 7.71-7.83(2H, m), 7.87-8.01(2H, m), 8.27(1H, s), 9.08(1H, s), 9.20(1H, s)。

【実施例7】1-[2, 3-ビス(p-クロロフェニル)-3-オキソプロピル]チオセミカルバジド (参-32) 0.37 g (1.0 mmol)、ジクロロメタン5 mlの混合物にp-(トリフルオロメチル)フェニルイソシアナート0.21 g (1.1 mmol) を加え、室温下2時間攪拌した。析出した固体をろ取し、乾燥させて0.43 gの2-[2, 3-ビス(p-クロロフェニル)-3-オキソプロピル]-1-チオカルバモイル-4-[p-(トリフルオロメチル)フェニル]セミカルバジド (No. 266) を無色固体として得た。Mp. 178-181℃。

【0208】IR(ヌジオール): 3440, 3270, 3150, 1670, 1612, 1595, 1530 cm⁻¹

同様に以下の化合物を得た。

【0209】No. 261 (参-19)、No. 267 (参-20)、No. 268 (参-20)、No. 269 (参-21)、No. 270 (参-22)、No. 271 (参-23)、No. 272 (参-23)。

【0210】【実施例8】4'-クロロ-2-(p-クロロフェニル)アクリロフェノン1.5 g (5.41 mmol)、シアノアセトヒドラジド0.80 g (8.07 mmol)、DMSO 8 mlの混合物を40℃で3時間、室温下15時間攪拌した。反応混合物を水20 mlにあげ、酢酸エチルで二回抽出した。乾燥(無水硫酸マグネシウム)、濃縮し、粗中間体を得た。この中間体0.5 g (1.33 mmol) のジエチルエーテル15 ml溶液にp-クロロフェニルイソシアナート0.21 g (1.33 mmol) を加え、室温下3時間攪拌した。反応混合物を濃縮し、固化した濃縮物をアセトニトリルで洗浄し、0.61 gの4-(p-クロロフェニル)-2-[2, 3-ビス(p-クロロフェニル)-3-オキソプロピル]-1-シアノアセチルセミカルバジド (No. 273) を無色固体として得た。Mp. 205℃ (分解)。

【0211】¹H-NMR(DMSO-d₆): 3.74(2H, s), 3.80-4.23(2H, br), 5.09(1H, t, J=6.6 Hz), 7.22-7.60(10H, m), 7.96(2H, d, J=8.6 Hz), 8.74(1H, s), 10.33(1H, s)。

同様にNo. 274を得た。

【0212】【実施例9】4'-クロロ-2-(p-クロロフェニル)アクリロフェノン0.5 g (1.80 mmol)、ジエチルエーテル8 mlの混合物にベンズアルデヒドヒドラゾン0.32 g (2.66 mmol) を加え室温下24時間攪拌した。次にp-クロロフェニルイソシアナート0.45 g (2.93 mmol) を加え、さらに15時間室温下で攪拌した。不溶物をろ過し、ろ液を濃縮し、カラムクロマトグラフィー(展開溶媒: ヘキサン/酢酸エチル=6/1)で精製し、0.39 gのベンズアルデヒド4-(p-クロロフェニル)-2-[2, 3-ビス(p-クロロフェニル)-3-オキソプロピル]セミカルバゾン (No. 289) を黄色固体として得た。Mp. 68-71℃。

【0213】¹H-NMR(CDCl₃): 4.31(1H, dd, J=14.6, 7.0 Hz), 4.62(1H, dd, J=14.6, 6.8 Hz), 5.18(1H, t, J=6.9 Hz), 7.22-7.55(15H, m), 7.65(1H, s), 7.81-7.86(1H, m), 8.67(1H, s)。

同様にNo. 290及びNo. 291を得た。

【0214】【実施例10】4'-ジフルオロメトキシ-2-(p-クロロフェニル)アクリロフェノン1.0 g (3.24 mmol)、エタノール5 mlの混合物にN, N-ジメチルヒドラジン0.27 ml (4.86 mmol) を加え室温下15時間攪拌した。反応混合物に水を加えてクロロホルムで三回抽出した。抽出液を乾燥(無水硫酸マグネシウム)後濃縮し、粗中間体1.18 gを得た。この中間体0.41 g (1.11 mmol)、p-クロロフェニルイソシアナート0.19 g (1.22 mmol)、ジエチルエーテル10 mlの混合物を室温下15時間攪拌した。反応混合物を濃縮し、カラムクロマトグラフィー(展開溶媒: ヘキサン/酢酸エチル=4/1)で精製し、0.27 gの4-(p-クロロフェニル)-2-[2-(p-クロロフェニル)-3-(p-ジフルオロメトキシフェニル)-3-オキソプロピル]-1, 1-ジメチルセミカルバジド (No. 468) を無色油状物として得た。

【0215】¹H-NMR(CDCl₃): 1.93(3H, s), 2.46(3H, s), 3.52(1H, dd, J=13.6, 8.0 Hz), 3.92(1H, dd, J=13.6, 5.8 Hz), 5.57(1H, dd, J=8.0, 5.8 Hz), 6.54(1H, t, J=7.2 Hz), 7.04-7.34(8H, m), 7.40-7.46(2H, m), 7.94-

8.00(2H, m), 8.61(1H, s).

同様に以下化合物を得た。

【0216】No. 157, No. 469, No. 475, No. 476, No. 577, No. 643, No. 786, No. 787, No. 788, No. 789, No. 502 (参-39), No. 656 (参-39), No. 657 (参-39), No. 551 (参-40), No. 670 (参-42), No. 671 (参-42), No. 672 (参-42), No. 673 (参-42), No. 683 (参-43), No. 684 (参-43), No. 685 (参-43), No. 689 (参-43), No. 691 (参-43), No. 692 (参-43), No. 693 (参-44), No. 716 (参-45), No. 717 (参-45), No. 718 (参-45), No. 719 (参-45), No. 766 (参-46), No. 767 (参-46), No. 772 (参-47), No. 776 (参-48), No. 784 (参-49), No. 785 (参-49)。

【0217】〔実施例11〕4'-ジフルオロメトキシ-2-(p-クロロフェニル)アクリロフェノン0.32g (1.02mmol)、エタノール5mlの混合物にアセトヒドラジド0.09g (1.12mmol)を加え室温下15時間攪拌した。反応混合物を濃縮し、残留物にジエチルエーテル10ml、p-クロロフェニルイソシアナート150mg (1.00mmol)を加え室温下15時間攪拌した。析出晶をろ過して、0.31gの1-アセチル-4-(p-クロロフェニル)-2-(2-(p-クロロフェニル)-3-(p-ジフルオロメトキシフェニル)-3-オキソプロピル)セミカルバジド (No. 470)を白色固体として得た。Mp. 135-136℃。

【0218】¹H-NMR(CDC1₃): 2.12(3H, s), 3.88(1H, br, s), 4.08(1H, br, s), 5.20(1H, br, s), 6.54(1H, t, J=72.8Hz), 7.06-7.36(10H, m), 7.46(1H, s), 7.76(1H, s), 7.92-7.96(2H, m)。

同様に以下化合物を得た。

【0219】〔実施例12〕4'-ジフルオロメトキシ-2-(p-クロロフェニル)アクリロフェノン0.32g (1.02mmol)、エタノール5mlの混合物にカルバジン酸メチル0.10g (1.12mmol)を加え、室温下15時間攪拌した。反応混合物を濃縮し、残留物にジエチルエーテル10ml、p-トリフルオロメチルフェニルイソシアナート230mg (1.23mmol)を加え室温下15時間攪拌した。反応混合物を濃縮し、カラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサン/酢酸エチル=1/1)で精製し、0.27gの2-(2-(p-クロロフェニル)-3-(p-ジフルオロメトキシフェニル)-3-オキソプロピル)-1-メトキシカルボニル-4-(p-トリフルオロメチルフェニル)セミカルバジド (No. 474)を白色固体として得た。Mp. 164-166℃。

【0220】¹H-NMR(CDC1₃): 3.81(3H, s), 3.70-3.90(1H, m), 4.10-4.20(1H, m), 5.22(1H, d, J=10.0, 4.6Hz), 6.53(1H, t, J=72.8Hz), 7.06-7.11(2H, m), 7.19-7.33(5H, m), 7.54(4H, s), 7.71(1H, s), 7.92-7.96(2H, m)。

同様に以下化合物を得た。

【0221】No. 71, No. 72, No. 366, No. 367, No. 368, No. 369, No. 438, No. 439, No. 443, No. 444, No. 466, No. 467, No. 775 (参-48)。

【0222】〔実施例13〕3'-クロロ-2-(p-クロロフェニル)アクリロフェノン(参-39)0.66g (2.38mmol)、エタノール10mlの混合物にカルバジン酸エチル0.37g (3.57mmol)を加え室温下15時間攪拌した。反応混合物に水を加えてクロロホルムで三回抽出した。抽出液を乾燥(無水硫酸マグネシウム)後濃縮し、粗中間体0.99gを得た。この中間体0.48g (1.15mmol)、p-クロロフェニルイソシアナート0.21g (1.38mmol)、ジエチルエーテル20mlの混合物を室温下2日間攪拌した。析出晶をろ取し、0.44gの4-(p-クロロフェニル)-2-(2-(p-クロロフェニル)-3-(m-クロロフェニル)-3-オキソプロピル)-1-エトキシカルボニルセミカルバジド (No. 501)を白色結晶として得た。Mp. 147-148℃。

¹H-NMR(CDC1₃): 1.31(3H, t, J=7.0Hz), 3.80(1H, br), 4.10(1H, br), 4.24(2H, q, J=7.0Hz), 5.20(1H, m), 6.90(1H, br), 7.19-7.45(11H, m), 7.72-7.77(1H, m), 7.90(2H, m)。

同様に以下化合物を得た。

【0223】〔実施例14〕4'-クロロ-3-ジメチルアミノプロピオフェノン塩酸塩1.0g (4.03mmol)、カルバジン酸エチル1.26g (12.1mmol)、トリエチルアミン1.68ml (12.1mmol)、クロロホルム5mlの混合物を室温下17時間攪拌した。反応混合物に水30mlを加えてクロロホルムで三回抽出した。抽出液を乾燥(無水硫酸マグネシウム)、濃縮後、カラムクロマトグラフィー(充填剤:中性アルミナ、展開溶媒:ヘキサン/酢酸エチル=1/1)で精製し、0.20gの3-(3-(p-クロロフェニル)-3-オキソプロピル)プロピオフェノンを白色結晶として得た。この中間体0.20g (0.74mmol)、p-クロロフェニルイソシアナート0.125g (0.814mmol)、ジエチルエーテル15mlの混合物を室温下2日間攪拌した。析出晶をろ取し、0.15gの4-(p-クロロフェニル)-2-(3-(p-クロロフェニル)-3-オキソプロピル)-1-エトキシカルボニルセミカルバジド (No. 502)を白色結晶として得た。Mp. 147-148℃。

ル) - 3-オキソプロピル) - 1-エトキシカルボニル
セミカルバジド (No. 534) を白色結晶として得た。
Mp. 147-149℃。

【0224】〔実施例15〕4'-クロロ-2-(4-
クロロ-1-ピラゾリル) アセトフェノン 0.62 g
(2.43 mmol)、N, N, N', N'-テトラメチル
ジアミノメタン 0.4 ml (2.92 mmol)、ジクロロメ
タン 10 ml の混合物を8時間加熱還流した。反応混合物
にヘキサン 20 ml を加え、析出した結晶をろ取り、0.
55 g の4'-クロロ-2-(4-クロロ-1-ピラゾ
リル) - 3-ジメチルアミノプロピオフェノンを白色結
晶として得た。

【0225】4'-クロロ-2-(4-クロロ-1-ピ
ラゾリル) - 3-ジメチルアミノプロピオフェノン 0.
55 g (1.76 mmol)、N, N-ジメチルヒドラジン
0.2 ml (2.64 mmol)、ジクロロメタン 10 ml の混
合物を6時間加熱還流した後、反応混合物に水 30 ml を
加えてクロロホルムで三回抽出した。抽出液を乾燥(無
水硫酸マグネシウム)、濃縮し、粗中間体を得た。この
中間体にジエチルエーテル 10 ml、p-トリフルオロメ
チルフェニルイソシアナート 330 mg (1.76 mmol)
を加え室温下2日間攪拌した。反応混合物を濃縮しカ
ラムクロマトグラフィー(展開溶媒: ヘキサン/酢酸エチ
ル=3/1)で精製し、0.16 g の2-[2-(p-
クロロフェニル)-3-(4-クロロ-1-ピラゾリ
ル)-3-オキソプロピル]-1, 1-ジメチル-4-
(p-トリフルオロメチルフェニル) セミカルバジ
ド (No. 592) を黄色油状物として得た。

【0226】¹H-NMR (CDCl₃): 1.93(3H, s), 2.
48(3H, s), 3.82(1H, dd, J=14.4, 9.8Hz), 4.02(1H, J=1
4.4, 4.0Hz), 6.57(1H, dd, J=9.8, 4.0Hz), 7.33-7.90(1
0H, m), 8.85(1H, s)。

同様にNo. 589及びNo. 590を得た。

【0227】〔実施例16〕1-2, 3-ビス(p-
クロロフェニル)-3-オキソプロピル-4-(p-
クロロフェニル) セミカルバジド (参-33) 0.10
1 g (0.218 mmol) の2 ml DMF 溶液にp-クロロ
フェニルイソチオシアナート 0.041 g (0.24 mm
ol) を加え、室温で5日間攪拌後濃縮した。残留物をジ
クロロメタンで三回洗浄し、0.092 g の1-[2,
3-ビス(p-クロロフェニル)-3-オキソプロピ
ル]-4-(p-クロロフェニル)-1-[N-(p-
クロロフェニル) チオカルバモイル] セミカルバジ
ド (No. 747) を得た。Mp. 179-185℃。

【0228】¹H-NMR (DMSO-d₆): 4.25-4.85
(2H, m), 5.42-5.57(1H, m), 7.15-7.60(14H, m), 7.85-7.
97(2H, m), 8.43(1H, br s), 9.13(1H, br s), 9.91(1H, br
s)。

同様にNo. 748 (参-23) を得た。

【0229】〔実施例17〕1, 2-ビス(p-クロロ

フェニル)-2-ブテン-1-オン 0.5 g (1.72
mmol)、エタノール 10 ml の混合物にN, N-ジメチル
ヒドラジン 0.18 ml (3.41 mmol) を加え室温下3
日間攪拌した。反応混合物に水を加えてクロロホルムで
三回抽出した。抽出液を乾燥(無水硫酸マグネシウム)
後濃縮し、粗中間体を得た。この中間体をジエチルエー
テル 10 ml に溶かし、p-クロロフェニルイソシアナート
0.29 g (1.89 mmol) を加え、室温下15時間
攪拌した。反応混合物を濃縮しカラムクロマトグラフィー
(展開溶媒: ヘキサン/酢酸エチル=5/1) で精製
し、0.21 g の4-(p-クロロフェニル)-2-
[2, 3-ビス(p-クロロフェニル)-1-メチル-
3-オキソプロピル]-1, 1-ジメチルセミカルバジ
ド (No. 762) を黄色アモルファスとして得た。

【0230】¹H-NMR (CDCl₃): (複雑)

同様にNo. 761を得た。

【0231】〔実施例18〕2-[3-(p-クロロフ
ェニル)-3-オキソ-2-(フェニルチオ)プロピ
ル]-1-エトキシカルボニル-4-(p-トリフルオ
ロメチルフェニル)-セミカルバジド (No. 775)
0.38 g (0.67 mmol) のジクロロメタン 10 ml 溶
液に、氷冷下でm-クロロ過安息香酸 0.37 g (70
%, 1.47 mmol) のジクロロメタン 5 ml 溶液を15分
間で滴下し、室温で20時間攪拌した。反応混合物をチ
オ硫酸ナトリウム水溶液及び重曹水で洗浄後、無水硫酸
マグネシウムで乾燥した。濃縮残渣をヘキサンとジエチ
ルエーテルの混合溶媒で洗浄し、0.40 g の2-[3-
(p-クロロフェニル)-3-オキソ-2-(フェニ
ルチオ)プロピル]-1-エトキシカルボニル-
4-(p-トリフルオロメチルフェニル) セミカルバジ
ド (No. 775) を白色結晶として得た。Mp. 170
-173℃

¹H-NMR (CDCl₃): 1.35(3H, t, J=7.2Hz), 4.00-
4.50(2H, br), 4.29(2H, q, J=7.2Hz), 5.70-5.80(1H, m),
7.33-7.78(15H, m)。

〔実施例19〕2-[2-(p-クロロ-N-メトキシ
カルボニルアニリノ)-3-(p-クロロフェニル)-
3-オキソプロピル]-1, 1-ジメチル-4-(p-
トリフルオロメチルフェニル) セミカルバジド (No. 7
85) 0.60 g (1.0 mmol)、ヨードトリメチルシ
ラン 0.17 ml (1.2 mmol)、ジクロロメタン 5 ml の
混合物を室温で15時間攪拌した。反応混合物にメタノ
ール 0.5 ml、30%酢酸水 15 ml を加えてジエチルエ
ーテルで三回抽出し、抽出液を水洗、乾燥(無水硫酸マ
グネシウム)した。濃縮後、カラムクロマトグラフィー
(展開溶媒: クロロホルム) で精製し、0.20 g の2-
[2-(p-クロロアニリノ)-3-(p-クロロフ
ェニル)-3-オキソプロピル]-1, 1-ジメチル-
4-(p-トリフルオロメチルフェニル) セミカルバジ
ド (No. 781) を黄色結晶として得た。Mp. 162

-164℃

$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$: 2.38(3H, s), 2.47(3H, s), 3.29(1H, dd, $J=13.8, 8.8\text{Hz}$), 3.71(1H, dd, $J=13.8, 4.4\text{Hz}$), 4.98(1H, br d), 5.75(1H, br), 6.63-6.69(2H, m), 7.03-7.07(2H, m), 7.46-7.52(2H, m), 7.56-7.67(4H, m), 8.22-8.26(2H, m), 8.77(1H, s).

【実施例20】窒素気流中、4'-クロロ-2-(p-クロロ-N-メチルアニリノ)アセトフェノン1.04g (3.54mmol)のTHF15ml溶液に-70℃でブチルリチウムヘキサン溶液2.3ml (1.6M, 3.68mmol)を滴下した。30分間同温度で撹拌後、ヨウ化N,N-ジメチルメチレンアンモニウム0.79g (4.29mmol)のTHF5ml溶液を加えた。-70℃で20分間撹拌し、2時間かけて室温まで昇温した。反応混合物に水を加えて酢酸エチルで三回抽出し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。濃縮残渣をジクロロメタン20mlに溶かし、N,N-ジメチルヒドラジン0.27ml (5.31mmol)を加え、室温で15時間撹拌した。反応混合物に水を加えてクロロホルムで三回抽出した。抽出液を乾燥(無水硫酸マグネシウム)後濃縮し、粗中間体を得た。この中間体をジエチルエーテル10mlに溶かし、p-(トリフルオロメチル)フェニルイソシアナート0.40g (2.12mmol)を加え、室温下18時間撹拌した。反応混合物を濃縮し、カラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサン/アセトン/エタノール=20/2/1)で精製し、0.11gの2-[2-(p-クロロ-N-メチルアニリノ)-3-(p-クロロフェニル)-3-オキソプロピル]-1,1-ジメチル-4-(p-トリフルオロメチルフェニル)セミカルバジド(No.783)を褐色油状物として得た。

【0232】 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$: 2.35(3H, s), 2.59(3H, s), 2.66(3H, s), 3.59(1H, dd, $J=14.2, 8.8\text{Hz}$), 3.91(1H, dd, $J=14.2, 4.2\text{Hz}$), 6.02(1H, dd, $J=8.8, 4.2\text{Hz}$), 6.75-6.80(2H, m), 7.12-7.17(2H, m), 7.51-7.69(8H, m), 8.82(1H, s).

【実施例21】2-アミノ-4'-クロロアセトフェノン塩酸塩1.0g (4.85mmol)、二炭酸ジ-t-ブチル1.58g (7.28mmol)、トリエチルアミン1.3ml (9.70mmol)、メタノール20mlの混合物を室温で18時間撹拌し、析出結晶をろ取し、1.06gのN-(4'-クロロフェナシル)カルバミン酸-t-ブチルを得た。

【0233】N-(4'-クロロフェナシル)カルバミン酸-t-ブチル0.91g (3.37mmol)、37%ホルムアルデヒド水溶液1.3ml (16.9mmol)、ピペリジン0.1ml、酢酸0.1ml、メタノール15mlの混

合物を、室温で20時間撹拌した。反応混合物に水を加えてクロロホルムで三回抽出した。抽出液を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、濃縮した。濃縮物をエタノール10mlに溶かし、N,N-ジメチルヒドラジン0.38ml (5.06mmol)を加えて室温で3日間撹拌した。反応混合物に水を加えてクロロホルムで三回抽出した。抽出液を乾燥(無水硫酸マグネシウム)後濃縮し、粗中間体を得た。この中間体、p-(トリフルオロメチル)フェニルイソシアナート0.63g (3.37mmol)、ジエチルエーテル20mlの混合物を室温下12時間撹拌した。反応混合物を濃縮し、カラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサン/酢酸エチル=2/1)で精製し、0.60gの2-[2-(t-ブトキシカルボニルアミノ)-3-(p-クロロフェニル)-3-オキソプロピル]-1,1-ジメチル-4-(p-トリフルオロメチルフェニル)セミカルバジド(No.790)を黄色アモルファスとして得た。

【0234】 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$: 1.59(9H, s), 2.52(3H, s), 2.57(3H, s), 3.50(1H, br), 3.70(1H, br), 5.70(2H, br), 7.40-7.70(8H, m), 8.15(1H, br).

【実施例22】4,4'-ジクロロカルコン0.5g (1.80mmol)、N,N-ジメチルヒドラジン0.21ml (2.76mmol)、ジエチルエーテル6ml、ジクロロメタン8mlの混合物を室温下1週間撹拌した。濃縮後、ジクロロメタン20mlに溶かし、水、飽和食塩水の順で洗浄した。無水硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮し、残留物をジクロロメタン15mlに溶かし、p-クロロフェニルイソシアナート(0.3g, 1.95mmol)を加え室温下一晩撹拌した。濃縮し、カラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサン/酢酸エチル=4/1、続いてヘキサン/クロロホルム=1/2)で精製し、0.49gの4-(p-クロロフェニル)-2-[1,3-ビス(p-クロロフェニル)-3-オキソプロピル]-1,1-ジメチルセミカルバジド(No.805)を無色固体として得た。Mp. 55-56℃。

【0235】 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$: 2.54(3H, s), 2.68(3H, s), 3.91(1H, dd, $J=18.3, 5.0\text{Hz}$), 4.09(1H, dd, $J=18.3, 7.4\text{Hz}$), 5.34(1H, dd, $J=7.4, 5.0\text{Hz}$), 7.21-7.28(2H, m), 7.37-7.52(6H, m), 7.90-7.97(2H, m), 8.70(1H, s).

【実施例23】4'-クロロ-2-(p-クロロフェニル)-3-[2-(エトキシカルボニル)ヒドラジノ]プロピオフェノン(参-13)0.5g (1.31mmol)、トリエチルアミン0.2ml (1.43mmol)、ジクロロメタン8mlの混合物に、塩化N-(p-クロロフェニル)-N-メチルカルバモイル0.29g (1.42mmol)を加え、室温で15時間撹拌した。塩化N-(p-クロロフェニル)-N-メチルカルバモイル0.13g (0.64mmol)を追加し、5時間加熱還流した後濃縮した。濃縮物にジエチルエーテル20mlを加え、水洗した。乾燥(無水硫酸マグネシウム)、濃縮後、カ

ラムクロマトグラフィー（展開溶媒：ヘキサン／酢酸エチル＝2／1、続いてヘキサン／アセトン＝4／1）で精製し、0.55gの2-〔2,3-ビス（p-クロロフェニル）-3-オキソプロピル〕-4-（p-クロロフェニル）-1-（エトキシカルボニル）-4-メチルセミカルバジド（No.813）をアモルファスとして得た。

【0236】¹H-NMR(CDCI₃): 1.17(3H, t, J=7.0Hz), 3.15(3H, s), 3.70-4.30(4H, m), 5.06(1H, t, J=7.1Hz), 5.87(1H, br s), 6.79(2H, br d), 7.13-7.44(8H, m), 7.83-7.93(2H, m).

同様にNo.818（参-1）を得た。

【0237】〔実施例24〕4'-クロロ-2-（p-クロロフェニル）-3-〔2-（プロボキシカルボニル）ヒドラジノ〕プロピオフェノン プロボキシカルボニルヒドラゾン（参-26）0.36g（0.72mmol）、ジエチルエーテル12mlの混合物にp-クロロフェニルイソシアナート0.12g（0.78mmol）を加え、室温下3時間撹拌した。析出した固体をろ取、乾燥させて、0.1gの4-（p-クロロフェニル）-2-〔2,3-ビス（p-クロロフェニル）-3-（プロボキシカルボニルヒドラゾノ）プロピル〕-1-（プロボキシカルボニル）セミカルバジド（No.842）を無色固体として得た。Mp. 164-165℃。

【0238】¹H-NMR(DMSO-d₆): 0.89(6H, t, J=7.4Hz), 1.50-1.70(4H, m), 3.95-4.09(4H, m), 4.29(2H, br. s), 6.99-7.07(2H, m), 7.18-7.57(10H, m), 8.88(1H, s), 9.39(1H, br. s), 9.70(1H, br. s).

〔実施例25〕1-（t-ブチルカルボニル）-4-（p-クロロフェニル）-2-〔2,3-ビス（p-クロロフェニル）プロピル〕セミカルバジド（No.847）1.0g（1.82mmol）のジクロロメタン15ml溶液にトリフルオロ酢酸1mlを加え、室温で15時間撹拌した。反応混合物を濃縮し、重曹水10mlを加えてジクロロメタンで抽出した。乾燥（無水硫酸マグネシウム）、濃縮後、ラムクロマトグラフィー（展開溶媒：ヘキサン／酢酸エチル＝2／1）で精製し、0.04gの4-（p-クロロフェニル）-2-〔2,3-ビス（p-クロロフェニル）プロピル〕セミカルバジド（No.843）を無色結晶として得た。Mp. 172-173℃。

【0239】¹H-NMR(CDCI₃): 2.84(1H, dd, J=13.8, 8.7Hz), 2.98(1H, dd, J=13.8, 5.9Hz), 3.22-3.41(3H, m), 3.51(1H, dd, J=13.9, 9.2Hz), 4.17(1H, dd, J=13.9, 5.9Hz), 6.89-7.01(2H, m), 7.05-7.45(10H, m), 8.40(1H, s).

〔実施例26〕N'-〔2,3-ビス（p-クロロフェニル）プロピル〕アセトヒドラジド（参-36）1.5g（4.45mmol）、DMF10mlの混合物にp-クロロフェニルイソシアナート0.72g（4.69mmol）

を加え、室温下15時間撹拌した。反応混合物を50mlの水にあげ、析出した固体をろ取し、乾燥させて1.8gの1-アセチル-4-（p-クロロフェニル）-2-〔2,3-ビス（p-クロロフェニル）プロピル〕セミカルバジド（No.844）を無色固体として得た。Mp. 187-190℃。

【0240】¹H-NMR(DMSO-d₆): 1.94(3H, s), 2.68-2.87(1H, m), 3.01-4.00(5H, m), 7.00-7.33(10H, m), 7.43-7.56(2H, m), 8.68(1H, s), 9.94(1H, s).

〔実施例27〕4-（p-クロロフェニル）-2-〔2,3-ビス（p-クロロフェニル）-3-オキソプロピル〕-1,1-ジメチルセミカルバジド（No.147）0.5g（1.02mmol）、エタノール20mlの混合物に水素化ホウ素ナトリウム0.04g（0.95mmol）を加え、室温下1時間撹拌した。濃縮後、飽和塩化アンモニウム水溶液を加えて中和し、酢酸エチル20mlで抽出した。水、飽和食塩水の順で洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮してラムクロマトグラフィー（展開溶媒：ヘキサン／酢酸エチル＝2／1）で精製し、0.43g（Rf大, No.853）及び0.06g（Rf小, No.854）の4-（p-クロロフェニル）-2-〔2,3-ビス（p-クロロフェニル）-3-ヒドロキシプロピル〕-1,1-ジメチルセミカルバジドをそれぞれ無色固体として得た。

【0241】No.853: Mp. 152-154℃。

【0242】¹H-NMR(CDCI₃): 2.57(3H, s), 2.74(3H, s), 3.02(1H, ddd, J=11.6, 4.7, 2.7Hz), 3.35(1H, dd, J=15.2, 4.7Hz), 4.25(1H, dd, J=15.2, 11.6Hz), 5.05(1H, d, J=2.7Hz), 6.90-6.97(2H, m), 7.01-7.19(6H, m), 7.23-7.31(2H, m), 7.43-7.50(2H, m), 8.76(1H, s).

No.854: Mp. 73-76℃。

【0243】¹H-NMR(CDCI₃): 2.16(3H, s), 2.35(3H, s), 3.18(1H, dt, J=8.4, 5.2Hz), 3.49(1H, dd, J=15.1, 5.2Hz), 4.19(1H, dd, J=15.1, 5.2Hz), 4.84(1H, d, J=8.4Hz), 6.97-7.31(10H, m), 7.41-7.49(2H, m), 8.55(1H, s).

同様にしてNo.160よりNo.855（Rf大）及びNo.856（Rf小）を得た。

【0244】〔実施例28〕4-（p-クロロフェニル）-2-〔2,3-ビス（p-クロロフェニル）-3-ヒドロキシプロピル〕-1,1-ジメチルセミカルバジド（Rf大の異性体, No.853）3.47g（7.04mmol）のピリジン20ml溶液に塩化メタンスルホン0.65ml（8.40mmol）を加え、室温で2日間撹拌した。反応混合物を濃縮後、1N塩酸100ml、酢酸エチル50mlを加え、不溶物をろ取した。水及び酢酸エチルで洗浄し、乾燥後、1.30gの4-（p-クロロフェニル）-2-〔2,3-ビス（p-クロロフェニル）-3-（メタンスルホンオキシ）プロピル〕-1,1-ジメチルセミカルバジド（No.863）を無色

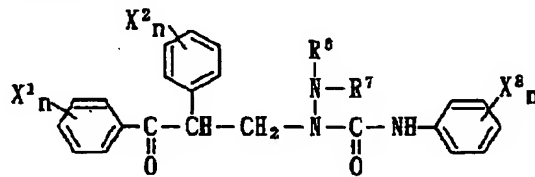
固体として得た。Mp. 215℃ (分解)。

【0245】¹H-NMR(DMSO-d₆): 2.32(3H, s), 3.42(3H, s), 3.77(3H, s), 4.23-4.56(2H, m), 4.70-4.73(1H, m), 5.81(1H, d, J=12.9Hz), 7.38-7.70(10H, m), 7.79-7.90(2H, m), 9.26(1H, s)。

上記実施例及び本発明に記載の製造法に従い製造できる本発明化合物の例を、上記実施例で得た化合物も含め、下記【表4】～【表5】に示す。

【0246】

* 【化28】



【0247】

* 【表4】

化合物 No.	X ¹ⁿ	X ²ⁿ	R ⁶ , R ⁷	X ⁸ⁿ	融点 (°C)
1	H	H	H, H	H	
2	H	H	Ac, H	p-Cl	168-169
3	H	H	Ac, H	p-CF ₃	159-161
4	H	H	EtOCO, H	p-Cl	153-154
5	H	H	EtOCO, H	p-CF ₃	181-182
6	H	H	Me, Me	p-Cl	(シロフ) ¹⁾
7	H	H	Me, Me	p-CF ₃	(シロフ) ²⁾
8	H	p-Cl	Me, H	p-Cl	
9	H	p-Cl	Ac, H	p-CF ₃	
10	H	p-CF ₃	MeOCO, H	H	
11	H	p-CHF ₂ O	Me, H	p-F	
12	p-Cl	H	H, H	H	
13	p-Cl	H	H, H	p-Cl	
14	p-Cl	H	H, H	p-CF ₃	
15	p-Cl	H	Me, H	H	
16	p-Cl	H	Me, H	p-F	
17	p-Cl	H	Me, H	p-Cl	

【0248】

【表5】

化合物 No.	X ¹ n	X ² n	R ⁶ , R ⁷	X ⁸ n	融点 (°C)
18	p-Cl	H	Me, H	m-Cl	(747777) ³⁾ (747777) ⁴⁾
19	p-Cl	H	Me, H	o-Cl	
20	p-Cl	H	Et, H	p-CHF ₂ O	
21	p-Cl	H	c-C ₃ H ₅ , H	p-CHF ₂ O	
22	p-Cl	H	t-Bu, H	p-NO ₂	
23	p-Cl	H	Me, Me	H	
24	p-Cl	H	Me, Me	p-F	
25	p-Cl	H	Me, Me	p-Cl	
26	p-Cl	H	Me, Me	m-Cl	
27	p-Cl	H	Me, Me	o-Cl	
28	p-Cl	H	Me, Me	p-CHF ₂ O	
29	p-Cl	H	Me, Me	p-CF ₃	
30	p-Cl	H	Me, Me	m-F	
31	p-Cl	H	Me, Et	o-Br	
32	p-Cl	H	CH ₂ CH ₂	p-CF ₃ O	
33	p-Cl	H	Ac, H	H	
34	p-Cl	H	Ac, H	p-Cl	
35	p-Cl	H	Ac, H	p-CF ₃	
36	p-Cl	H	Ac, H	m-Br	
37	p-Cl	H	Ac, H	o-F	
38	p-Cl	H	Ac, H	2,4-Cl ₂	
39	p-Cl	H	EtCO, H	H	
40	p-Cl	H	EtCO, H	p-Cl	

[0249]

【表6】

化合物 No.	X ¹ .	X ² .	R ⁶ , R ⁷	X ⁸ⁿ	融点 (°C)
41	p-Cl	H	EtCO, H	p-CF ₃	
42	p-Cl	H	EtCO, H	p-Br	
43	p-Cl	H	EtCO, H	F ₅	
44	p-Cl	H	EtCO, H	2,5-Cl ₂	
45	p-Cl	H	PrCO, H	o-Cl	
46	p-Cl	H	PrCO, H	p-CHF ₂ O	
47	p-Cl	H	i-PrCO, H	p-NO ₂	
48	p-Cl	H	i-PrCO, H	H	
49	p-Cl	H	i-PrCO, H	p-F	
50	p-Cl	H	i-PrCO, H	p-Cl	
51	p-Cl	H	n-BuCO, H	p-Cl	
52	p-Cl	H	s-BuCO, H	p-CF ₃ SO ₂	
53	p-Cl	H	t-BuCO, H	p-CHF ₂ O	
54	p-Cl	H	MeOCH ₂ CO, H	p-F	
55	p-Cl	H	EtOCH ₂ CO, H	p-Br	
56	p-Cl	H	MeOCH ₂ CH ₂ CO, H	p-CF ₃ O	
57	p-Cl	H	MeSCH ₂ CO, H	p-Cl	
58	p-Cl	H	CF ₃ CH ₂ CO, H	o-Cl	
59	p-Cl	H	C ₆ F ₅ CO, H	p-CHF ₂ O	
60	p-Cl	H	PhCH ₂ CO, H	p-NO ₂	
61	p-Cl	H	PhCH ₂ CH ₂ CO, H	p-CF ₃	
62	p-Cl	H	MeOCO, H	H	
63	p-Cl	H	MeOCO, H	p-Cl	

[0250]

[表7]

81

82

化合物 No.	X ¹ _n	X ² _n	R ⁶ , R ⁷	X ⁸ _n	融点 (°C)
64	p-Cl	H	MeOCO, H	p-CF ₃	166-168 (アセチル) ⁵⁾
65	p-Cl	H	MeOCO, H	m-Br	
66	p-Cl	H	MeOCO, H	o-F	
67	p-Cl	H	MeOCO, H	2,4-Cl ₂	
68	p-Cl	H	MeOCO, H	o-Me	
69	p-Cl	H	MeOCO, H	p-CCl ₃	
70	p-Cl	H	EtOCO, H	H	
71	p-Cl	H	EtOCO, H	p-Cl	
72	p-Cl	H	EtOCO, H	p-CF ₃	
73	p-Cl	H	EtOCO, H	p-Me	
74	p-Cl	H	EtOCO, H	p-MeO	
75	p-Cl	H	EtOCO, H	p-CHF ₂ O	
76	p-Cl	H	EtOCO, H	2,4-Cl ₂	
77	p-Cl	H	EtOCO, H	p-CCl ₃	
78	p-Cl	H	PrOCO, H	p-Cl	
79	p-Cl	H	PrOCO, H	p-CHF ₂ O	
80	p-Cl	H	i-PrOCO, H	p-Cl	
81	p-Cl	H	i-PrOCO, H	p-F	
82	p-Cl	H	i-PrOCO, H	p-Br	
83	p-Cl	H	i-PrOCO, H	p-I	
84	p-Cl	H	i-PrOCO, H	p-Ph	
85	p-Cl	H	n-BuOCO, H	p-Cl	
86	p-Cl	H	s-BuOCO, H	p-CF ₃ SO ₂	

[0251]

[表8]

83

84

化合物 No.	X ¹ n	X ² n	R ⁶ , R ⁷	X ⁸ n	融点 (°C)
87	p-Cl	H	t-BuOCO, H	p-Cl	
88	p-Cl	H	t-BuOCO, H	p-CHF ₂ O	
89	p-Cl	H	MeOCH ₂ OCO, H	p-Br	
90	p-Cl	H	PhOCO, H	p-CF ₃ O	
91	p-Cl	H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ OCO, H	p-Cl	
92	p-Cl	H	CF ₃ CH ₂ OCO, H	o-Cl	
93	p-Cl	H	C ₆ F ₅ OCO, H	p-CHF ₂ O	
94	p-Cl	H	PhCH ₂ OCO, H	p-NO ₂	
95	p-Cl	H	p-Cl-C ₆ H ₄ CH ₂ OCO, H	p-CF ₃	
96	p-Cl	H	Ac, Me	p-F	
97	p-Cl	H	MeOCH ₂ CO, Me	p-Cl	
98	p-Cl	H	MeOCO, Me	H	
99	p-Cl	H	EtOCO, Me	p-F	
100	p-Cl	H	EtOCO, Me	p-Cl	
101	p-Cl	H	EtOCO, Me	p-Br	
102	p-Cl	H	EtOCO, Me	p-CF ₃	
103	p-Cl	H	EtOCO, Me	p-CHF ₂ O	
104	p-Cl	H	PrOCO, Me	p-Cl	
105	p-Cl	H	PrOCO, Me	p-CHF ₂ O	
106	p-Cl	H	i-PrOCO, Me	p-Cl	
107	p-Cl	H	i-PrOCO, Me	p-F	
108	p-Cl	H	i-PrOCO, Me	p-Br	
109	p-Cl	H	t-BuOCO, Me	p-Cl	

【0252】

【表9】

化合物 No.	X ¹ n	X ² n	R ⁶ , R ⁷	X ³ n	融点 (°C)
110	p-Cl	H	Succinyl	p-CF ₃	
111	p-Cl	H	Phthaloyl	p-Cl	
112	p-Cl	o-Cl	H, H	H	
113	p-Cl	o-Cl	Ac, H	p-Cl	
114	p-Cl	o-F	Ac, H	p-CF ₃	
115	p-Cl	o-Br	EtOCO, H	p-Cl	
116	p-Cl	o-CF ₃	EtOCO, H	p-CF ₃	
117	p-Cl	o-MeO	Me, Me	p-CF ₃	
118	p-Cl	o-CHF ₂ O	i-PrOCO, H	p-Cl	
119	p-Cl	o-CF ₃ O	Ac, H	p-CF ₃	
120	p-Cl	o-MeS	MeOCO, H	H	
121	p-Cl	o-CN	MeOCH ₂ CO, H	p-F	
122	p-Cl	o-Me	MeOCO, Me	p-Cl	
123	p-Cl	m-Cl	Ac, H	H	
124	p-Cl	m-Cl	EtOCO, H	p-Cl	
125	p-Cl	m-F	Ac, H	p-CF ₃	
126	p-Cl	m-Br	EtOCO, H	p-Cl	
127	p-Cl	m-CF ₃	MeOCO, H	p-CF ₃	
128	p-Cl	m-PhO	MeOCO, Me	p-Cl	
129	p-Cl	m-MeO	Me, Me	p-CF ₃	
130	p-Cl	m-CHF ₂ O	i-PrOCO, H	p-Cl	
131	p-Cl	m-CF ₃ SO ₃	Ac, H	p-CF ₃	
132	p-Cl	m-MeS	MeOCO, H	p-CF ₃ SO ₃	

[0253]

[表10]

化合物 No.	X ¹ n	X ² n	R ⁶ , R ⁷	X ⁸ n	融点 (°C)
133	p-Cl	m-CN	MeOCH ₂ CO, H	p-F	61-63
134	p-Cl	m-Cl	Succinyl	p-CF ₃	
135	p-Cl	p-Cl	H, H	H	
136	p-Cl	p-Cl	H, H	p-Cl	
137	p-Cl	p-Cl	H, H	p-CF ₃	
138	p-Cl	p-Cl	Me, H	H	
139	p-Cl	p-Cl	Me, H	p-F	
140	p-Cl	p-Cl	Me, H	p-Cl	
141	p-Cl	p-Cl	Me, H	m-Cl	
142	p-Cl	p-Cl	PhCOCH ₂ , H	o-Cl	
143	p-Cl	p-Cl	Et, H	p-CHF ₂ O	
144	p-Cl	p-Cl	t-Bu, H	p-NO ₂	
145	p-Cl	p-Cl	Me, Me	H	
146	p-Cl	p-Cl	Me, Me	p-F	
147	p-Cl	p-Cl	Me, Me	p-Cl	
148	p-Cl	p-Cl	Me, Me	m-Cl	
149	p-Cl	p-Cl	Me, Me	o-Cl	
150	p-Cl	p-Cl	Me, Me	p-CF ₃	
151	p-Cl	p-Cl	Me, Me	p-CHF ₂ O	
152	p-Cl	p-Cl	Me, Me	p-CF ₃ O	
153	p-Cl	p-Cl	Me, Et	m-F	
154	p-Cl	p-Cl	Et, Et	p-Br	
155	p-Cl	p-Cl	Me, PhCH ₂	p-Cl	

[0254]

[表11]

89

90

化合物 No.	X ¹ n	X ² n	R ⁸ , R ⁷	X ⁸ n	融点 (°C)
156	p-Cl	p-Cl	CH ₂ CH ₂	p-CF ₃ O	<77777> ⁸⁾
157	p-Cl	p-Cl	(CH ₂) ₅	p-Cl	
158	p-Cl	p-Cl	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂	p-Cl	
159	p-Cl	p-Cl	Ac, H	H	
160	p-Cl	p-Cl	Ac, H	p-Cl	76-78
161	p-Cl	p-Cl	Ac, H	p-CF ₃	122-123
162	p-Cl	p-Cl	Ac, H	m-Br	
163	p-Cl	p-Cl	Ac, H	o-F	
164	p-Cl	p-Cl	Ac, H	2,4-Cl ₂	
165	p-Cl	p-Cl	EtCO, H	H	94-96
166	p-Cl	p-Cl	EtCO, H	p-Cl	
167	p-Cl	p-Cl	EtCO, H	p-CF ₃	
168	p-Cl	p-Cl	EtCO, H	p-Br	
169	p-Cl	p-Cl	EtCO, H	F ₅	115-117
170	p-Cl	p-Cl	EtCO, H	2,5-Cl ₂	
171	p-Cl	p-Cl	PrCO, H	p-Cl	
172	p-Cl	p-Cl	PrCO, H	o-Cl	
173	p-Cl	p-Cl	PrCO, H	p-CF ₃	143-144
174	p-Cl	p-Cl	PrCO, H	p-CHF ₂ O	
175	p-Cl	p-Cl	i-PrCO, H	p-NO ₂	
176	p-Cl	p-Cl	i-PrCO, H	H	
177	p-Cl	p-Cl	i-PrCO, H	p-F	142-144
178	p-Cl	p-Cl	i-PrCO, H	p-Cl	

【0255】

【表12】

91

92

化合物 No.	X ¹ _n	X ² _n	R ⁶ , R ⁷	X ⁸ _n	融点 (°C)
179	p-Cl	p-Cl	i-PrCO, H	p-CF ₃	109-110
180	p-Cl	p-Cl	n-BuCO, H	p-Cl	159-161
181	p-Cl	p-Cl	n-BuCO, H	p-CF ₃	132-133
182	p-Cl	p-Cl	s-BuCO, H	p-CF ₃ SO ₃	
183	p-Cl	p-Cl	t-BuCO, H	p-CHF ₂ O	
184	p-Cl	p-Cl	Me ₂ C=CHCO, H	p-CF ₃	
185	p-Cl	p-Cl	MeOCH ₂ CO, H	p-Cl	155-157
186	p-Cl	p-Cl	MeOCH ₂ CO, H	p-CF ₃	(747772) ¹⁰⁾
187	p-Cl	p-Cl	MeOCH ₂ CO, H	p-CF ₃ O	84-85
188	p-Cl	p-Cl	EtOCH ₂ CO, H	p-Br	
189	p-Cl	p-Cl	MeOCH ₂ CH ₂ CO, H	p-CF ₃ O	
190	p-Cl	p-Cl	MeSCH ₂ CO, H	p-Cl	178-179
191	p-Cl	p-Cl	MeSCH ₂ CO, H	p-CF ₃	172-173
192	p-Cl	p-Cl	CF ₃ CH ₂ CO, H	o-Cl	
193	p-Cl	p-Cl	EtCOCH ₂ CO, H	p-Cl	
194	p-Cl	p-Cl	PhCH ₂ CO, H	p-NO ₂	
195	p-Cl	p-Cl	PhCH ₂ CH ₂ CO, H	p-CF ₃	
196	p-Cl	p-Cl	PhOCH ₂ CO, H	p-Cl	107-109
197	p-Cl	p-Cl	PhCO, H	p-Cl	184-187
198	p-Cl	p-Cl	p-Cl-C ₆ H ₄ CO, H	p-Cl	133-135
199	p-Cl	p-Cl	p-NO ₂ -C ₆ H ₄ CO, H	p-Cl	175-177
200	p-Cl	p-Cl	o-(HOCH ₂)-C ₆ H ₄ CO, H	p-Cl	167
201	p-Cl	p-Cl	C ₆ F ₅ CO, H	p-CHF ₂ O	

[0256]

[表13]

化合物 No.	X ¹ n	X ² n	R ⁶ , R ⁷	X ³ n	融点 (°C)
202	p-Cl	p-Cl	3-Nicotinoyl, H	p-Cl	206-207
203	p-Cl	p-Cl	CH=N-N=CH	p-Cl	208-209
204	p-Cl	p-Cl	MeOCO, H	p-Cl	162-164
205	p-Cl	p-Cl	MeOCO, H	p-CF ₃	
206	p-Cl	p-Cl	MeOCO, H	m-Br	
207	p-Cl	p-Cl	MeOCO, H	2,4-Cl ₂	
208	p-Cl	p-Cl	MeOCO, H	o-Me	
209	p-Cl	p-Cl	MeOCO, H	p-CCl ₃	
210	p-Cl	p-Cl	EtOCO, H	H	115-117
211	p-Cl	p-Cl	EtOCO, H	p-Cl	165-167
212	p-Cl	p-Cl	EtOCO, H	m-Cl	152-153
213	p-Cl	p-Cl	EtOCO, H	o-Cl	168-169
214	p-Cl	p-Cl	EtOCO, H	p-CF ₃	158-160
215	p-Cl	p-Cl	EtOCO, H	p-Br	168-169
216	p-Cl	p-Cl	EtOCO, H	p-Me	148-150
217	p-Cl	p-Cl	EtOCO, H	p-MeO	153-155
218	p-Cl	p-Cl	EtOCO, H	p-CHF ₂ O	
219	p-Cl	p-Cl	EtOCO, H	p-CF ₃ O	78-80
220	p-Cl	p-Cl	EtOCO, H	p-MeS	
221	p-Cl	p-Cl	EtOCO, H	p-MeSO ₂	
222	p-Cl	p-Cl	EtOCO, H	p-F	148-149
223	p-Cl	p-Cl	EtOCO, H	2,4-F ₂	
224	p-Cl	p-Cl	EtOCO, H	2,5-F ₂	

[0257]

[表14]

95

96

化合物 No.	X ¹ _n	X ² _n	R ⁶ , R ⁷	X ⁸ _n	融点 (°C)
225	p-Cl	p-Cl	EtOCO, H	2, 6-F ₂	154-156
226	p-Cl	p-Cl	EtOCO, H	3, 4-F ₂	
227	p-Cl	p-Cl	EtOCO, H	3, 5-F ₂	
228	p-Cl	p-Cl	EtOCO, H	2, 4, 6-F ₃	
229	p-Cl	p-Cl	EtOCO, H	2, 3, 4, 5-F ₄	
230	p-Cl	p-Cl	EtOCO, H	F ₆	
231	p-Cl	p-Cl	EtOCO, H	2, 3-Cl ₂	
232	p-Cl	p-Cl	EtOCO, H	2, 4-Cl ₂	
233	p-Cl	p-Cl	EtOCO, H	2, 5-Cl ₂	
234	p-Cl	p-Cl	EtOCO, H	2, 6-Cl ₂	
235	p-Cl	p-Cl	EtOCO, H	3, 4-Cl ₂	
236	p-Cl	p-Cl	EtOCO, H	3, 5-Cl ₂	
237	p-Cl	p-Cl	EtOCO, H	2, 4, 6-Cl ₃	
238	p-Cl	p-Cl	EtOCO, H	p-Cl ₃ C	
239	p-Cl	p-Cl	PrOCO, H	p-Cl	
240	p-Cl	p-Cl	PrOCO, H	p-CHF ₂ O	
241	p-Cl	p-Cl	i-PrOCO, H	p-Cl	154-155
242	p-Cl	p-Cl	i-PrOCO, H	p-F	
243	p-Cl	p-Cl	i-PrOCO, H	p-Br	
244	p-Cl	p-Cl	i-PrOCO, H	p-I	
245	p-Cl	p-Cl	i-PrOCO, H	p-Ph	
246	p-Cl	p-Cl	n-BuOCO, H	p-Cl	
247	p-Cl	p-Cl	s-BuOCO, H	p-CF ₃ SO ₃	

[0258]

[表15]

97		98			
化合物 No.	X ¹ n	X ² n	R ⁶ , R ⁷	X ³ n	融点 (°C)
248	p-Cl	p-Cl	t-BuOCO, H	p-Cl	95-97
249	p-Cl	p-Cl	t-BuOCO, H	p-CHF ₂ O	
250	p-Cl	p-Cl	MeOCH ₂ OCO, H	p-Br	
251	p-Cl	p-Cl	PhOCO, H	p-Cl	
252	p-Cl	p-Cl	PhOCO, H	p-CF ₃ O	92-94
253	p-Cl	p-Cl	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ OCO, H	p-Cl	
254	p-Cl	p-Cl	CF ₃ CH ₂ OCO, H	p-Cl	
255	p-Cl	p-Cl	CF ₃ CH ₂ OCO, H	p-CF ₃	
256	p-Cl	p-Cl	CF ₃ CH ₂ OCO, H	o-Cl	185-187
257	p-Cl	p-Cl	C ₆ F ₅ OCO, H	p-CHF ₂ O	
258	p-Cl	p-Cl	PhCH ₂ OCO, H	p-CF ₃	
259	p-Cl	p-Cl	p-Cl-C ₆ H ₄ CH ₂ OCO, H	p-CF ₃	
260	p-Cl	p-Cl	MeNHCO, H	p-Cl	209-213
261	p-Cl	p-Cl	EtNHCO, H	p-CF ₃	
262	p-Cl	p-Cl	PhNHCO, H	p-CF ₃ O	
263	p-Cl	p-Cl	p-Cl-C ₆ H ₄ NHCO, H	p-CF ₃	
264	p-Cl	p-Cl	Me ₂ NCO, H	p-Cl	195-200
265	p-Cl	p-Cl	(CH ₂) ₄ NCO, H	p-Cl	
266	p-Cl	p-Cl	H ₂ NCS, H	p-CF ₃	
267	p-Cl	p-Cl	MeNHCS, H	p-Cl	
268	p-Cl	p-Cl	MeNHCS, H	p-CF ₃	167-173
269	p-Cl	p-Cl	EtNHCS, H	p-CF ₃	
270	p-Cl	p-Cl	PhNHCS, H	p-CF ₃	
					178-182
					159-161

[0259]

[表16]

化合物 No.	X ¹ n	X ² n	R ⁶ , R ⁷	X ³ n	融点 (°C)
271	p-Cl	p-Cl	p-Cl-C ₆ H ₄ NHCS, H	p-Cl	133-137
272	p-Cl	p-Cl	p-Cl-C ₆ H ₄ NHCS, H	p-CF ₃	161.5-163
273	p-Cl	p-Cl	NCCH ₂ CO, H	p-Cl	205 (分解)
274	p-Cl	p-Cl	NCCH ₂ CO, H	p-CF ₃	198 (分解)
275	p-Cl	p-Cl	MeOCO, Me	p-Br	
276	p-Cl	p-Cl	EtOCO, Me	m-Cl	
277	p-Cl	p-Cl	EtOCO, Me	p-Cl	(774777) ¹¹⁾
278	p-Cl	p-Cl	EtOCO, Me	p-CF ₃	(774777) ¹²⁾
279	p-Cl	p-Cl	EtOCO, Me	p-MeO	
280	p-Cl	p-Cl	PrOCO, Me	p-Cl	
281	p-Cl	p-Cl	PrOCO, Me	p-CHF ₂ O	
282	p-Cl	p-Cl	i-PrOCO, Me	p-Cl	
283	p-Cl	p-Cl	i-PrOCO, Me	p-F	
284	p-Cl	p-Cl	i-PrOCO, Me	p-Br	
285	p-Cl	p-Cl	t-BuOCO, Me	p-Cl	
286	p-Cl	p-Cl	Ac, Ac	p-Cl	
287	p-Cl	p-Cl	Succinyl	p-CF ₃	
288	p-Cl	p-Cl	Phthaloyl	p-Cl	
289	p-Cl	p-Cl	PhCH=	p-Cl	68-71
290	p-Cl	p-Cl	p-Cl-C ₆ H ₄ CH=	p-Cl	66-68
291	p-Cl	p-Cl	p-NO ₂ -C ₆ H ₄ CH=	p-Cl	180-182
292	p-Cl	p-F	H, H	H	
293	p-Cl	p-F	Me, Me	p-CF ₃	

[0260]

【表17】

101

102

化合物 No.	X ¹ _n	X ² _n	R ⁶ , R ⁷	X ³ _n	融点 (°C)
294	p-Cl	p-F	Ac, H	p-Cl	
295	p-Cl	p-F	Ac, H	p-CF ₃	
296	p-Cl	p-F	MeOCH ₂ CO, H	p-F	
297	p-Cl	p-F	MeOCO, H	H	
298	p-Cl	p-F	MeOCO, Me	p-Cl	
299	p-Cl	p-F	EtOCO, H	p-Cl	
300	p-Cl	p-F	EtOCO, H	p-CF ₃	
301	p-Cl	p-F	i-PrCO, H	p-CF ₃	
302	p-Cl	p-Br	H, H	H	
303	p-Cl	p-Br	Me, Me	p-CF ₃	
304	p-Cl	p-Br	Ac, H	p-Cl	
305	p-Cl	p-Br	Ac, H	p-CF ₃	
306	p-Cl	p-Br	MeOCH ₂ CO, H	p-F	
307	p-Cl	p-Br	MeOCO, H	H	
308	p-Cl	p-Br	MeOCO, Me	p-Cl	
309	p-Cl	p-Br	EtOCO, H	p-Cl	
310	p-Cl	p-Br	EtOCO, H	p-CF ₃	
311	p-Cl	p-Br	PrOCO, H	p-Cl	
312	p-Cl	p-Br	i-PrCO, H	p-CF ₃	
313	p-Cl	p-Br	Succinyl	p-CF ₃	
314	p-Cl	p-I	H, H	H	
315	p-Cl	p-I	Me, Me	p-CF ₃	
316	p-Cl	p-I	Ac, H	p-CF ₃	

[0261]

【表18】

103

104

化合物 No.	X ¹ n	X ² n	R ⁶ , R ⁷	X ⁸ n	融点 (°C)
317	p-Cl	p-I	MeOCH ₂ CO, H	p-F	
318	p-Cl	p-I	MeOCO, H	H	
319	p-Cl	p-I	MeOCO, Me	p-Cl	
320	p-Cl	p-I	EtOCO, H	p-Cl	
321	p-Cl	p-I	EtOCO, H	p-CF ₃	
322	p-Cl	p-I	PrOCO, H	p-Cl	
323	p-Cl	p-I	i-PrCO, H	p-CF ₃	
324	p-Cl	p-I	Succinyl	p-CF ₃	
325	p-Cl	p-CF ₃	H, H	H	
326	p-Cl	p-CF ₃	Me, Me	p-CF ₃	
327	p-Cl	p-CF ₃	Ac, H	p-Cl	
328	p-Cl	p-CF ₃	Ac, H	p-CF ₃	
329	p-Cl	p-CF ₃	MeOCH ₂ CO, H	p-F	
330	p-Cl	p-CF ₃	MeOCO, H	H	
331	p-Cl	p-CF ₃	MeOCO, Me	p-Cl	
332	p-Cl	p-CF ₃	EtOCO, H	p-Cl	
333	p-Cl	p-CF ₃	EtOCO, H	p-CF ₃	
334	p-Cl	p-CF ₃	PrOCO, H	p-Cl	
335	p-Cl	p-CF ₃	i-PrCO, H	p-CF ₃	
336	p-Cl	p-CF ₃	Succinyl	p-CF ₃	
337	p-Cl	p-CHF ₂ O	H, H	H	
338	p-Cl	p-CHF ₂ O	Me, Me	p-CF ₃	
339	p-Cl	p-CHF ₂ O	Ac, H	p-CF ₃	

[0262]

【表19】

化合物 No.	X ¹ n	X ² n	R ⁶ , R ⁷	X ⁶ n	融点 (°C)
340	p-Cl	p-CHF ₂ O	MeOCH ₂ CO, H	p-F	
341	p-Cl	p-CHF ₂ O	MeOCO, H	H	
342	p-Cl	p-CHF ₂ O	MeOCO, Me	p-Cl	
343	p-Cl	p-CHF ₂ O	EtOCO, H	p-Cl	
344	p-Cl	p-CHF ₂ O	EtOCO, H	p-CF ₃	
345	p-Cl	p-CHF ₂ O	PrOCO, H	p-Cl	
346	p-Cl	p-CHF ₂ O	i-PrCO, H	p-CF ₃	
347	p-Cl	p-CHF ₂ O	Succinyl	p-CF ₃	
348	p-Cl	p-CF ₃ SO ₃	H, H	H	
349	p-Cl	p-CF ₃ SO ₃	Me, Me	p-CF ₃	
350	p-Cl	p-CF ₃ SO ₃	Ac, H	p-Cl	
351	p-Cl	p-CF ₃ SO ₃	Ac, H	p-CF ₂	
352	p-Cl	p-CF ₃ SO ₃	MeOCH ₂ CO, H	p-F	
353	p-Cl	p-CF ₃ SO ₃	MeOCO, H	H	
354	p-Cl	p-CF ₃ SO ₃	MeOCO, Me	p-Cl	
355	p-Cl	p-CF ₃ SO ₃	EtOCO, H	p-Cl	
356	p-Cl	p-CF ₃ SO ₃	EtOCO, H	p-CF ₃	
357	p-Cl	p-CF ₃ SO ₃	PrOCO, H	p-Cl	
358	p-Cl	p-CF ₃ SO ₃	i-PrCO, H	p-CF ₃	
359	p-Cl	p-CF ₃ SO ₃	Succinyl	p-CF ₃	
360	p-Cl	p-Me	Me, H	H	
361	p-Cl	p-Me	Me, Me	p-Cl	(7モル77入) ¹³⁾
362	p-Cl	p-Me	Me, Me	p-CF ₃	(7モル77入) ¹⁴⁾

[0263]

【表20】

107

108

化合物 No.	X ¹ n	X ² n	R ⁶ , R ⁷	X ³ n	融点 (°C)
363	p-Cl	p-Me	EtOCO, H	p-Cl	158-160
364	p-Cl	p-Me	EtOCO, H	p-CF ₃	150-151
365	p-Cl	p-MeO	Me, Me	p-CF ₃	
366	p-Cl	p-MeO	Ac, H	p-Cl	(74.7-77.7) ^{1.5)}
367	p-Cl	p-MeO	Ac, H	p-CF ₃	(74.7-77.7) ^{1.6)}
368	p-Cl	p-MeO	EtOCO, H	p-Cl	(74.7-77.7) ^{1.7)}
369	p-Cl	p-MeO	EtOCO, H	p-CF ₃	(74.7-77.7) ^{1.8)}
370	p-Cl	p-MeS	Ac, H	p-CF ₃	
371	p-Cl	p-MeSO	MeOCH ₂ CO, H	p-F	
372	p-Cl	p-MeSO ₂	MeOCO, H	H	
373	p-Cl	p-MeSO ₃	MeOCO, Me	p-Cl	
374	p-Cl	p-CH ₂ F	EtOCO, H	p-Cl	
375	p-Cl	p-CF ₃ O	EtOCO, H	p-CF ₃	
376	p-Cl	p-CBrF ₂ O	PrOCO, H	p-Cl	
377	p-Cl	p-CClF ₂ O	i-PrCO, H	p-CF ₃	
378	p-Cl	p-CBr ₂ F	Succinyl	p-CF ₃	
379	p-Cl	p-F	Me, H	H	
380	p-Cl	2,4-F ₂	Me, Me	p-CF ₃	
381	p-Cl	2,5-F ₂	Ac, H	p-Cl	
382	p-Cl	2,6-F ₂	Ac, H	p-CF ₃	
383	p-Cl	3,4-F ₂	MeOCH ₂ CO, H	p-F	
384	p-Cl	3,5-F ₂	MeOCO, H	H	
385	p-Cl	2,4,6-F ₃	MeOCO, Me	p-Cl	

[0264]

【表21】

化合物 No.	X ¹ⁿ	X ²ⁿ	R ⁶ , R ⁷	X ³ⁿ	融点 (°C)
386	p-Cl	2, 3, 4, 5-F ₄	EtOCO, H	p-Cl	
387	p-Cl	F ₅	EtOCO, H	p-CF ₃	
388	p-Cl	2, 3-Cl ₂	PrOCO, H	p-Cl	
389	p-Cl	2, 4-Cl ₂	i-PrCO, H	p-CF ₃	
390	p-Cl	2, 5-Cl ₂	Succinyl	p-CF ₃	
391	p-Cl	2, 6-Cl ₂	H, H	H	
392	p-Cl	3, 4-Cl ₂	Me, Me	p-CF ₃	
393	p-Cl	3, 5-Cl ₂	Ac, H	p-CF ₃	
394	p-Cl	2, 4, 6-Cl ₃	MeOCH ₂ CO, H	p-F	
395	p-Cl	p-CCl ₃	MeOCO, H	H	
396	p-Cl	p-CN	MeOCO, Me	p-Cl	
397	p-Cl	p-Et	EtOCO, H	p-Cl	
398	p-Cl	p-Ph	EtOCO, H	p-CF ₃	
399	p-Cl	p-PhO	PrOCO, H	p-Cl	
400	p-Cl	2, 4-Me ₂	i-PrCO, H	p-CF ₃	
401	p-Cl	3, 4-(MeO) ₂	Succinyl	p-CF ₃	
402	p-F	H	H, H	p-CF ₃	
403	p-F	H	Me, Me	p-Cl	(747777) ¹⁹⁾
404	p-F	H	Me, Me	p-CF ₃	(747777) ²⁰⁾
405	p-F	H	CH ₂ CH ₂	p-CF ₃ O	
406	p-F	H	MeOCH ₂ CO, H	p-F	
407	p-F	H	EtOCO, H	p-Cl	(747777) ²¹⁾
408	p-F	H	EtOCO, H	p-CF ₃	(747777) ²²⁾

[0265]

【表22】

111

112

化合物 No.	X ¹ n	X ² n	R ⁶ , R ⁷	X ⁸ n	融点 (°C)
409	p-F	p-Cl	Me, H	p-F	
410	p-F	p-Cl	Me, Me	p-F	
411	p-F	p-Cl	Ac, H	m-Br	
412	p-F	p-Cl	MeOCH ₂ CO, H	p-F	
413	p-F	p-Cl	MeOCO, H	2,4-Cl ₂	
414	p-F	p-Cl	EtOCO, H	p-Cl	
415	p-F	p-Cl	EtOCO, H	p-CF ₃	
416	p-F	p-Cl	EtOCO, H	p-CHF ₂ O	
417	p-F	p-Cl	EtOCO, H	p-F	
418	p-F	p-Cl	EtOCO, H	3,4-Methyl -enedioxy	
419	p-F	p-Cl	MeOCH ₂ CO, Me	p-Cl	
420	p-F	p-Br	MeOCH ₂ CO, H	p-F	
421	p-F	p-F	MeOCO, Me	p-F	
422	p-F	p-CF ₃	Ac, H	p-CF ₃	
423	p-F	p-CHF ₂ O	Succinyl	p-CF ₃	
424	p-F	p-PhO	PrOCO, H	p-Cl	
425	p-F	2,4-Me ₂	i-PrCO, H	p-CF ₃	
426	p-F	3,4-(MeO) ₂	EtOCO	p-CF ₃	
427	p-Br	p-Cl	MeOCH ₂ CO, H	p-Cl	
428	p-Br	p-Cl	MeOCO, H	2,4-Cl ₂	
429	p-Br	p-Cl	EtOCO, H	p-Br	
430	p-Br	p-Cl	EtOCO, H	p-CF ₃	

[0266]

【表23】

113

114

化合物 No.	X ¹ _n	X ² _n	R ⁶ , R ⁷	X ⁸ _n	融点 (°C)
431	p-Br	p-Cl	EtOCO, H	p-CHF ₂ O	
432	p-Br	p-Br	MeOCH ₂ CO, Me	p-Br	
433	p-I	p-Cl	MeOCH ₂ CO, H	p-Cl	
434	p-I	p-Cl	MeOCO, H	p-Cl	
435	p-Me	p-Cl	MeOCH ₂ CO, H	p-Cl	
436	p-MeO	H	Me, Me	p-Cl	(シロフ) ²³⁾
437	p-MeO	H	Me, Me	p-CF ₃	(シロフ) ²⁴⁾
438	p-MeO	H	EtOCO, H	p-Cl	(アモルナス) ²⁵⁾
439	p-MeO	H	EtOCO, H	p-CF ₃	(アモルナス) ²⁶⁾
440	p-MeO	p-Cl	MeOCO, H	p-Cl	
441	p-MeO	p-MeO	Me, Me	p-Cl	(アモルナス) ²⁷⁾
442	p-MeO	p-MeO	Me, Me	p-CF ₃	(アモルナス) ²⁸⁾
443	p-MeO	p-MeO	EtOCO, H	p-Cl	(アモルナス) ²⁹⁾
444	p-MeO	p-MeO	EtOCO, H	p-CF ₃	(アモルナス) ³⁰⁾
445	p-MeS	p-Cl	EtOCO, H	p-Br	
446	p-MeSO	p-Cl	EtOCO, H	p-CF ₃	
447	p-MeSO ₂	p-Cl	EtOCO, H	p-CHF ₂ O	
448	p-MeSO ₃	p-Br	MeOCH ₂ CO, Me	p-Br	
449	p-PhSO ₃	p-Cl	MeOCH ₂ CO, H	p-Cl	
450	p-CF ₃ O	p-Cl	MeOCO, H	p-Cl	
451	p-CBrF ₃ O	p-Cl	MeOCH ₂ CO, H	p-Cl	
452	p-CClF ₂ O	p-Cl	MeOCO, H	p-Cl	
453	p-CBr ₂ FO	p-Cl	EtOCO, H	p-CF ₃	

[0267]

[表24]

115

116

化合物 No.	X ¹ n	X ² n	R ⁶ , R ⁷	X ⁸ n	融点 (°C)
454	p-CN	p-Cl	EtOCO, H	p-CF ₃	
455	p-Et	p-Cl	EtOCO, H	p-CHF ₂ O	
456	p-CF ₂ CF ₃	p-Br	MeOCH ₂ CO, Me	p-Br	
457	p-CF ₃ O	p-Cl	MeOCH ₂ CO, Me	p-Cl	
458	p-CF ₃	p-Cl	MeOCH ₂ CO, H	p-Cl	
459	p-CF ₃	p-Cl	MeOCO, H	2,4-Cl ₂	
460	p-CF ₃	p-Cl	EtOCO, H	p-Br	
461	p-CF ₃	p-Cl	EtOCO, H	p-CF ₃	
462	p-CF ₃	p-Cl	EtOCO, H	p-CHF ₂ O	
463	p-CF ₃	p-CF ₃	MeOCH ₂ CO, Me	p-CF ₃	
464	p-CHF ₂ O	H	Me, Me	p-Cl	(シロフ) ³¹⁾
465	p-CHF ₂ O	H	Me, Me	p-CF ₃	(シロフ) ³²⁾
466	p-CHF ₂ O	H	EtOCO, H	p-Cl	(7モ777) ³³⁾
467	p-CHF ₂ O	H	EtOCO, H	p-CF ₃	(7モ777) ³⁴⁾
468	p-CHF ₂ O	p-Cl	Me, Me	p-Cl	(シロフ) ³⁵⁾
469	p-CHF ₂ O	p-Cl	Me, Me	p-CF ₃	(7モ777) ³⁶⁾
470	p-CHF ₂ O	p-Cl	Ac, H	p-Cl	135-136
471	p-CHF ₂ O	p-Cl	Ac, H	p-CF ₃	143-145
472	p-CHF ₂ O	p-Cl	MeOCH ₂ CO, H	p-Cl	
473	p-CHF ₂ O	p-Cl	MeOCO, H	p-Cl	130-132
474	p-CHF ₂ O	p-Cl	MeOCO, H	p-CF ₃	164-166
475	p-CHF ₂ O	p-Cl	EtOCO, H	p-Cl	102-105
476	p-CHF ₂ O	p-Cl	EtOCO, H	p-CF ₃	101-103

[0268]

[表25]

化合物 No.	X ¹ n	X ² n	R ⁶ , R ⁷	X ⁸ n	融点 (°C)
477	p-CHF ₂ O	p-Cl	EtOCO, H	p-CHF ₂ O	
478	p-CF ₃ SO ₃	p-Cl	MeOCH ₂ CO, Me	p-CF ₃ SO ₃	
479	p-CF ₃ SO ₃	p-Cl	MeOCH ₂ CO, H	p-Cl	
480	p-CF ₃ SO ₃	p-Cl	MeOCO, H	2,4-Cl ₂	
481	p-CF ₃ SO ₃	p-Cl	EtOCO, H	p-Br	
482	p-CF ₃ SO ₃	p-Cl	EtOCO, H	p-CF ₃	
483	p-CF ₃ SO ₃	p-Cl	EtOCO, H	p-CHF ₂ O	
484	p-CF ₃ SO ₃	p-F	EtOCO, H	p-CHF ₂ O	
485	p-CF ₃ SO ₃	p-F	MeOCO, H	2,4-Cl ₂	
486	p-CF ₃ SO ₃	p-F	EtOCO, H	p-Br	
487	p-CF ₃ SO ₃	p-CN	EtOCO, H	p-CF ₃	
488	p-CF ₃ SO ₃	p-CF ₃	EtOCO, H	p-CHF ₂ O	
489	p-CF ₃ SO ₃	p-CF ₃ O	MeOCH ₂ CO, Me	p-Br	
490	o-Cl	p-Cl	Ac, H	p-Cl	
491	o-F	p-Cl	Ac, H	p-CF ₃	
492	o-CF ₃	p-Cl	EtOCO, H	p-CF ₃	
493	o-MeO	p-Cl	Me, Me	p-CF ₃	
494	o-CF ₃ O	p-Cl	Ac, H	p-CF ₃	
495	o-MeS	p-Cl	MeOCO, H	H	
496	o-CN	p-Cl	MeOCH ₂ CO, H	p-F	
497	o-Me	p-Cl	MeOCO, Me	p-Cl	
498	m-Cl	p-Cl	Me, Me	p-Cl	(74777λ) ³⁷⁾
499	m-Cl	p-Cl	Me, Me	p-CF ₃	(74777λ) ³⁸⁾

[0269]

【表26】

化合物 No.	X ¹ n	X ² n	R ⁶ , R ⁷	X ⁸ n	融点 (°C)
500	m-Cl	p-Cl	Ac, H	H	147-148 (774777) ³⁰⁾
501	m-Cl	p-Cl	EtOCO, H	p-Cl	
502	m-Cl	p-Cl	EtOCO, H	p-CF ₃	
503	m-F	p-Cl	Ac, H	p-CF ₃	
504	m-CF ₃	p-Cl	MeOCO, H	p-CF ₃	
505	m-PhO	p-Cl	MeOCO, Me	p-Cl	
506	m-CHF ₂ O	p-Cl	i-PrOCO, H	p-Cl	
507	m-CF ₃ SO ₃	p-Cl	Ac, H	p-CF ₃	
508	m-MeS	p-Cl	MeOCO, H	p-CF ₃ SO ₃	
509	m-CN	p-Cl	MeOCH ₂ CO, H	p-F	
510	m-Cl	p-Cl	Succinyl	p-CF ₃	
511	2,4-F ₂	p-Cl	Me, Me	p-CF ₃	
512	2,5-F ₂	p-Cl	Ac, H	p-Cl	
513	2,6-F ₂	p-Cl	Ac, H	p-CF ₃	
514	3,4-F ₂	p-Cl	MeOCH ₂ CO, H	p-F	
515	3,5-F ₂	p-Cl	MeOCO, H	H	
516	2,4,6-F ₃	p-Cl	MeOCO, Me	p-Cl	
517	2,3,4,5-F ₄	p-Cl	EtOCO, H	p-Cl	
518	F ₅	p-Cl	EtOCO, H	p-CF ₃	
519	2,3-Cl ₂	p-Cl	PrOCO, H	p-Cl	
520	2,4-Cl ₂	p-Cl	i-PrCO, H	p-CF ₃	
521	2,5-Cl ₂	p-Cl	Succinyl	p-CF ₃	
522	2,6-Cl ₂	p-Cl	H, H	H	

[0270]

【表27】

121

122

化合物 No.	X ¹ _n	X ² _n	R ⁶ , R ⁷	X ³ _n	融点 (°C)
523	3,4-Cl ₂	p-Cl	Me, Me	p-CF ₃	
524	3,5-Cl ₂	p-Cl	Ac, H	p-CF ₃	
525	2,4,6-Cl ₃	p-Cl	MeOCH ₂ CO, H	p-F	
526	2-F-4-Cl	p-Cl	i-PrCO, H	p-CF ₃	
527	3-F-4-Cl	p-Cl	Succinyl	p-CF ₃	
528	2-F-4-CF ₃	p-Cl	EtOCO, H	p-Cl	
529	2-Cl-4-CF ₃	p-Cl	EtOCO, H	p-CF ₃	
530	2,4-Me ₂	p-Cl	PrOCO, H	p-Cl	
531	2,6-Me ₂	p-Cl	i-PrCO, H	p-CF ₃	
532	2,4,6-Me ₃	p-Cl	Succinyl	p-CF ₃	
533	3,4-(MeO) ₂	p-Cl	Succinyl	p-CF ₃	

1) NMR (CDCl₃): 1.86 (3H, s), 2.45 (3H, s), 3.56 (1H, dd, J=13.8, 8.2 Hz), 3.96 (1H, dd, J=13.8, 5.8 Hz), 5.61 (1H, dd, J=8.2, 5.8 Hz), 7.13-7.47 (12H, m), 7.94-7.99 (2H, m), 8.63 (1H, s).

2) NMR (CDCl₃): 1.86 (3H, s), 2.47 (3H, s), 3.59 (1H, dd, J=13.6, 8.4 Hz), 3.98 (1H, dd, J=13.6, 5.8 Hz), 5.61 (1H, dd, J=8.4, 5.8 Hz), 7.16-7.65 (12H, m), 7.94-7.99 (2H, m), 8.83 (1H, s).

3) NMR (CDCl₃): 1.84 (3H, s), 2.46 (3H, s), 3.54 (1H, dd, J=13.6, 8.4 Hz), 3.95 (1H, dd, J=13.6, 5.6 Hz), 5.56 (1H, dd, J=8.4, 5.6 Hz), 7.18-7.47 (11H, m), 7.86-7.92 (2H, m), 8.62 (1H, s).

4) NMR (CDCl₃): 1.85 (3H, s), 2.47 (3H, s), 3.57 (1H, dd, J=13.8, 8.4 Hz), 3.97 (1H, dd, J=13.8, 5.6 Hz), 5.56 (1H, dd, J=8.4, 5.6 Hz), 7.21-7.35 (6H, m), 7.52-7.64 (5H, m), 7.86-7.92 (2H, m), 8.82 (1H, s).

【0271】

【表28】

123

124

- 5) NMR (CDCl₃): 1.30 (3H, t, J=7.0 Hz), 3.90 (1H, br), 4.15 (1H, br), 4.24 (2H, q, J=7.0 Hz), 5.20 (1H, m), 7.22-7.35 (8H, m), 7.54 (4H, s), 7.73 (1H, br), 7.85-7.89 (2H, m).
- 6) NMR (CDCl₃): 1.94 (3H, s), 2.48 (3H, s), 3.55 (1H, dd, J=13.7, 8.3 Hz), 3.95 (1H, dd, J=13.7, 5.8 Hz), 5.57 (1H, dd, J=8.3, 5.8 Hz), 7.26-7.40 (6H, m), 7.51-7.67 (4H, m), 7.86-7.95 (2H, m), 8.82 (1H, s).
- 7) NMR (CDCl₃): 1.93 (3H, s), 2.47 (3H, s), 3.53 (1H, dd, J=13.7, 8.2 Hz), 3.94 (1H, dd, J=13.7, 5.9 Hz), 5.58 (1H, dd, J=8.2, 5.9 Hz), 7.12-7.20 (2H, m), 7.24-7.39 (6H, m), 7.47-7.56 (2H, m), 7.85-7.94 (2H, m), 8.66 (1H, s).
- 8) NMR (CDCl₃): 実施例5に記載。
- 9) NMR (CDCl₃): 0.92-1.21 (1H, m), 1.30-1.82 (5H, m), 1.90-2.21 (2H, m), 2.62-2.75 (2H, m), 3.58 (1H, dd, J=13.6, 7.9 Hz), 3.96 (1H, dd, J=13.6, 6.2 Hz), 5.58 (1H, dd, J=7.9, 6.2 Hz), 7.21-7.46 (10H, m), 7.84-7.92 (2H, m), 8.70 (1H, s).
- 10) NMR (CDCl₃): 3.49 (3H, s), 3.92-4.15 (4H, m), 5.20 (1H, t, J=7.0 Hz), 7.16-7.40 (6H, m), 7.52 (4H, s), 7.71 (1H, s), 7.81-7.93 (2H, m), 8.40 (1H, s).
- 11) IR (CDCl₃): 3340, 1710, 1680, 1590, 1520, 1490cm⁻¹
- 12) IR (CDCl₃): 3340, 1710, 1680, 1590, 1527, 1490cm⁻¹
- 13) NMR (CDCl₃): 1.88 (3H, s), 2.27 (3H, s), 2.46 (3H, s), 3.52 (1H, dd, J=13.6, 8.2 Hz), 3.92 (1H, dd, J=13.6, 5.8 Hz), 5.51 (1H, dd, J=8.2, 5.8 Hz), 7.06-7.46 (10H, m), 7.87-7.91 (2H, m), 8.60 (1H, s).

[0272]

[表29]

125

126

14) NMR (CDCl₃): 1.88 (3H, s), 2.27 (3H, s), 2.48 (3H, s), 3.55 (1H, dd, J=13.6, 8.4 Hz), 3.94 (1H, dd, J=13.6, 5.8 Hz), 5.51 (1H, dd, J=8.4, 5.8 Hz), 7.06-7.35 (6H, m), 7.52-7.64 (4H, m), 7.87-7.92 (2H, m), 8.81 (1H, s).

15) NMR (CDCl₃): 2.12 (3H, s), 3.76 (3H, s), 3.80-3.90 (1H, m), 4.00-4.10 (1H, m), 5.10-5.20 (1H, m), 6.81-6.86 (2H, m), 7.14-7.36 (8H, m), 7.44 (1H, br), 7.62 (1H, br), 7.84-7.89 (2H, m).

16) NMR (CDCl₃): 2.09 (3H, s), 3.75 (3H, s), 3.80-4.10 (2H, m), 5.10-5.20 (1H, m), 6.81-6.86 (2H, m), 7.13-7.35 (6H, m), 7.52-7.65 (2H, br), 7.81-7.88 (2H, m).

17) NMR (CDCl₃): 1.30 (3H, t, J=7.2 Hz), 3.76 (3H, s), 3.70-3.90 (1H, br), 4.00-4.15 (1H, br), 4.23 (2H, q, J=7.2 Hz), 5.20 (1H, m), 6.81-6.86 (2H, m), 7.15-7.52 (9H, m), 7.51 (1H, br), 7.84-7.89 (2H, m).

18) NMR (CDCl₃): 1.30 (3H, t, J=7.0 Hz), 3.76 (3H, s), 3.80 (1H, br), 4.10 (1H, br), 4.24 (2H, q, J=7.0 Hz), 5.10-5.20 (1H, m), 6.82-6.87 (2H, m), 7.16-7.35 (4H, m), 7.54 (4H, s), 7.73 (1H, br), 7.84-7.89 (2H, m).

19) NMR (CDCl₃): 1.85 (3H, s), 2.46 (3H, s), 3.55 (1H, dd, J=13.6, 8.2 Hz), 3.94 (1H, dd, J=13.6, 5.6 Hz), 5.57 (1H, dd, J=8.2, 5.6 Hz), 6.84-7.47 (11H, m), 7.95-8.03 (2H, m), 8.61 (1H, s).

20) NMR (CDCl₃): 1.85 (3H, s), 2.48 (3H, s), 3.57 (1H, dd, J=13.6, 8.4 Hz), 3.96 (1H, dd, J=13.6, 5.6 Hz), 5.56 (1H, dd, J=8.4, 5.6 Hz), 6.98-7.07 (2H, m), 7.21-7.35 (5H, m), 7.52-7.64 (4H, m), 7.96-8.03 (2H, m), 8.81 (1H, s).

21) NMR (CDCl₃): 1.29 (3H, t, J=7.2 Hz), 3.85 (1H, br), 4.10 (1H, br), 4.22 (2H, q, J=7.2 Hz), 5.22 (1H, dd, J=9.6, 4.8 Hz), 6.97-7.07 (2H, m), 7.21-7.40 (9H, m), 7.56 (1H, br), 7.93-8.00 (2H, m).

[0273]

【表30】

127

128

22) NMR (CDCl₃): 1.33 (3H, t, J=7.2 Hz), 3.90 (1H, br), 4.10 (1H, br), 4.24 (2H, q, J=7.2 Hz), 5.20 (1H, dd, J=9.6, 5.0 Hz), 6.98-7.07 (2H, m), 7.26-7.34 (6H, m), 7.54 (4H, s), 7.75 (1H, br), 7.93-8.01 (2H, m).

23) NMR (CDCl₃): 1.86 (3H, s), 2.45 (3H, s), 3.56 (1H, dd, J=13.6, 8.2 Hz), 3.79 (3H, s), 3.95 (1H, dd, J=13.6, 6.4 Hz), 5.56 (1H, t, J=6.4 Hz), 6.78-6.93 (2H, m), 7.18-7.48 (9H, m), 7.93-7.98 (2H, m), 8.63 (1H, s).

24) NMR (CDCl₃): 1.86 (3H, s), 2.46 (3H, s), 3.58 (1H, dd, J=13.8, 8.2 Hz), 3.78 (3H, s), 3.97 (1H, dd, J=13.8, 5.8 Hz), 5.56 (1H, dd, J=8.2, 5.8 Hz), 6.80-6.84 (2H, m), 7.18-7.65 (9H, m), 7.93-7.99 (2H, m), 8.83 (1H, s).

25) NMR (CDCl₃): 1.29 (3H, t, J=7.2 Hz), 3.80 (3H, s), 3.70-4.00 (1H, br), 4.00-4.20 (1H, br), 4.22 (2H, q, J=7.2 Hz), 5.22 (1H, dd, J=9.8, 4.6 Hz), 6.80-6.85 (2H, m), 7.21-7.40 (10H, m), 7.60 (1H, br), 7.90-7.95 (2H, m).

26) NMR (CDCl₃): 1.28 (3H, t, J=7.2 Hz), 3.79 (3H, s), 3.90 (1H, br), 4.10 (1H, br), 4.22 (2H, q, J=7.2 Hz), 5.22 (1H, dd, J=9.8, 4.6 Hz), 6.80-6.85 (2H, m), 7.10 (1H, br), 7.23-7.33 (5H, m), 7.49-7.59 (4H, m), 7.87 (1H, br), 7.90-7.95 (2H, m).

27) NMR (CDCl₃): 1.91 (3H, s), 2.46 (3H, s), 3.53 (1H, dd, J=13.6, 8.6 Hz), 3.75 (3H, s), 3.80 (3H, s), 3.91 (1H, dd, J=13.6, 5.8 Hz), 5.50 (1H, dd, J=8.2, 5.8 Hz), 6.74-6.85 (4H, m), 7.23-7.28 (4H, m), 7.41-7.49 (2H, m), 7.93-7.97 (2H, m), 8.63 (1H, s).

28) NMR (CDCl₃): 1.91 (3H, s), 2.48 (3H, s), 3.55 (1H, dd, J=13.6, 8.6 Hz), 3.74 (3H, s), 3.80 (3H, s), 3.92 (1H, dd, J=13.6, 6.0 Hz), 5.50 (1H, dd, J=8.6, 6.0 Hz), 6.78-6.88 (4H, m), 7.23-7.28 (2H, m), 7.51-7.64 (4H, m), 7.89-7.98 (2H, m), 8.82 (1H, s).

[0274]

【表31】

129

130

29) NMR (CDCl₃): 1.28 (3H, t, J=7.0 Hz), 3.75 (3H, s), 3.80 (4H, m), 4.10 (1H, br), 4.22 (2H, q, J=7.0 Hz), 5.16 (1H, dd, J=9.6, 4.8 Hz), 6.80-6.85 (4H, m), 7.00 (1H, br), 7.18-7.26 (4H, m), 7.33-7.40 (2H, m), 7.61 (1H, s), 7.89-7.94 (2H, m).

30) NMR (CDCl₃): 1.29 (3H, t, J=7.0 Hz), 3.75 (3H, s), 3.80 (4H, m), 4.10 (1H, br), 4.23 (2H, q, J=7.0 Hz), 5.16 (1H, dd, J=9.8, 5.0 Hz), 6.80-6.86 (4H, m), 7.05 (1H, br), 7.19-7.23 (2H, m), 7.54 (4H, s), 7.83 (1H, br), 7.90-7.95 (2H, m).

31) NMR (CDCl₃): 1.85 (3H, s), 2.45 (3H, s), 3.55 (1H, dd, J=13.6, 8.4 Hz), 3.95 (1H, dd, J=13.6, 5.6 Hz), 5.57 (1H, dd, J=8.4, 5.6 Hz), 6.52 (1H, t, J=73.0 Hz), 7.03-7.47 (11H, m), 7.96-8.01 (2H, m), 8.63 (1H, s).

32) NMR (CDCl₃): 1.85 (3H, s), 2.48 (3H, s), 3.57 (1H, dd, J=13.6, 8.4 Hz), 3.97 (1H, dd, J=13.6, 5.6 Hz), 5.57 (1H, dd, J=8.4, 5.6 Hz), 6.52 (1H, t, J=73.0 Hz), 7.02-7.35 (7H, m), 7.52-7.64 (4H, m), 7.96-8.02 (2H, m).

33) NMR (CDCl₃): 1.29 (3H, t, J=7.2 Hz), 3.70-4.00 (1H, m), 4.10 (1H, br), 4.22 (2H, q, J=7.2 Hz), 5.23 (1H, dd, J=9.6, 4.8 Hz), 6.52 (1H, t, J=72.8 Hz), 6.90 (1H, br), 7.03-7.08 (2H, m), 7.21-7.39 (9H, m), 7.55 (1H, s), 7.93-7.99 (2H, m).

34) NMR (CDCl₃): 1.29 (3H, t, J=7.2 Hz), 3.86 (1H, br), 4.11 (1H, br), 4.23 (2H, q, J=7.2 Hz), 5.23 (1H, dd, J=9.6, 5.0 Hz), 6.52 (1H, t, J=72.8 Hz), 6.90 (1H, br), 7.03-7.09 (2H, m), 7.26-7.38 (7H, m), 7.47-7.59 (2H, m), 7.79 (1H, s), 7.92-7.99 (2H, m).

35) NMR (CDCl₃): 実施例10に記載。

[0275]

[表32]

133

134

化合物 No.	R ¹	A-C-B	R ² , R ³	R ⁴ , R ⁵	R ⁶ , R ⁷	R ¹ , R ⁸	X	融点 (°C)
534	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	H, H	H, H	EtOCO, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	147-149
535	2-Naphthyl	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
536	6-Cl-2-naphthyl	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	MeOCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
537	2-Thienyl	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
538	5-Cl-2-thienyl	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	EtOCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
539	3-Furyl	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	MeOCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
540	2-Pyridyl	C=O	p-F-C ₆ H ₄ , H	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
541	3-Pyridyl	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	MeOCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
542	4-Pyridyl	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	EtOCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
543	4-Cl-2-pyridyl	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	EtOCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
544	5-Cl-2-pyridyl	C=O	Ph, H	H, H	EtOCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
545	5-Cl-2-pyridyl	C=O	p-Br-C ₆ H ₄ , H	H, H	EtOCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
546	6-Cl-2-pyridyl	C=O	Ph, H	H, H	EtOCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
547	6-Cl-3-pyridyl	C=O	Ph, H	H, H	EtOCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
548	6-Cl-3-pyridyl	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	EtOCO, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
549	6-Cl-3-pyridyl	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	EtOCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	174-177
550	6-Cl-3-pyridyl	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	EtOCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
551	6-Cl-3-pyridyl	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	EtOCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	78-72 ¹⁾
552	6-Cl-3-pyridyl	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	Me, Me	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
553	2-Cl-5-thiazolyl	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	Me, Me	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
554	2-Cl-5-thiazolyl	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	MeOCO, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	

[0278]

40 【発34】

135

136

化合物 No.	R ¹	A-C-B	R ² , R ³	R ⁴ , R ⁵	R ⁴ , R ⁵	R ⁴ , R ⁵	X	融点 (°C)
555	3-Cl-1-isidazo[1,2-a]pyridin-8-yl	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	EtOCO, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
556	3-CF ₃ -1-isidazo[1,2-a]pyridin-8-yl	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	EtOCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
557	3-CN-1-isidazo[1,2-a]pyridin-8-yl	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	EtOCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
558	3-NO ₂ -1-isidazo[1,2-a]pyridin-8-yl	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	EtOCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
559	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	2-Naphthyl, H	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
560	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	6-Cl-2-naphthyl, H	H, H	MeOCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
561	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	2-Thienyl, H	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
562	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	5-Cl-2-thienyl, H	H, H	EtOCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
563	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	2-Furyl, H	H, H	MeOCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
564	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	3-Furyl, H	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
565	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	1-Pyrrolyl, H	H, H	MeOCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
566	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	1-Pyrrolyl, H	H, H	MeOCO, Me	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
567	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	2-Cl-1-pyrrolyl, H	H, H	EtOCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
568	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	2-Cl-1-pyrrolyl, H	H, H	Me, Et	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
569	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	3-CF ₃ -1-pyrrolyl, H	H, H	Me, Me	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
570	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	2,3-Cl ₂ -1-pyrrolyl, H	H, H	Me, Me	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
571	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	1-Me-2-pyrrolyl, H	H, H	MeOCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
572	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	1-Me-3-pyrrolyl, H	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
573	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	1-Et-2-pyrrolyl, H	H, H	EtOCO, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
574	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	1-Ph-3-pyrrolyl, H	H, H	Me, Me	p-Br-C ₆ H ₄ , H	0	

[0279]

40 【表35】

137

138

化合物 No.	R ¹	A-C-B	R ² , R ³	R ⁴ , R ⁵	R ⁶ , R ⁷	R ⁸ , R ⁹	X	融点 (°C)
575	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	1-Pyrazolyl, H	H, H	MeCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	137-139
576	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	1-Pyrazolyl, H	H, H	EtOCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	744772 ¹¹
577	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	1-Pyrazolyl, H	H, H	Me, Me	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
578	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	1-Pyrazolyl, H	H, H	Me, Me	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
579	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	4-Me-1-pyrazolyl, H	H, H	EtOCO, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
580	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	4-F-1-pyrazolyl, H	H, H	EtOCO, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
581	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	4-Br-1-pyrazolyl, H	H, H	MeCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
582	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	4-Br-1-pyrazolyl, H	H, H	Me, Me	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
583	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	3-Cl-1-pyrazolyl, H	H, H	EtOCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
584	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	3-Cl-1-pyrazolyl, H	H, H	EtOCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
585	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	4-Cl-1-pyrazolyl, H	H, H	MeOCH ₂ CO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
586	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	4-Cl-1-pyrazolyl, H	H, H	MeOCH ₂ CO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
587	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	4-Cl-1-pyrazolyl, H	H, H	MeCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
588	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	4-Cl-1-pyrazolyl, H	H, H	EtOCO, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
589	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	4-Cl-1-pyrazolyl, H	H, H	EtOCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	744772 ¹¹
590	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	4-Cl-1-pyrazolyl, H	H, H	EtOCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	744772 ¹¹
591	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	4-Cl-1-pyrazolyl, H	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
592	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	4-Cl-1-pyrazolyl, H	H, H	Me, Me	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	744772 ¹¹
593	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	4-Cl-1-pyrazolyl, H	H, H	Me, Me	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
594	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	5-Cl-1-pyrazolyl, H	H, H	EtOCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
595	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	5-Cl-1-pyrazolyl, H	H, H	Me, Me	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
596	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	4-CF ₃ -1-pyrazolyl, H	H, H	MeOCH ₂ CO, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
597	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	4-CF ₃ -1-pyrazolyl, H	H, H	MeOCH ₂ CO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
598	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	4-CF ₃ -1-pyrazolyl, H	H, H	MeCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	

139

140

化合物 No.	R ¹	A-C-B	R ² , R ³	R ⁴ , R ⁵	R ⁶ , R ⁷	R ⁸ , R ⁹	X	融点 (°C)
599	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	4-CF ₃ -1-pyrazolyl, H	H, H	MeCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
600	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	4-CF ₃ -1-pyrazolyl, H	H, H	EtOCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
601	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	4-CF ₃ -1-pyrazolyl, H	H, H	EtOCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
602	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	4-CF ₃ -1-pyrazolyl, H	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
603	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	4-CF ₃ -1-pyrazolyl, H	H, H	Me, Me	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
604	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	4-CF ₃ -1-pyrazolyl, H	H, H	Me, Me	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
605	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	4-NO ₂ -1-pyrazolyl, H	H, H	EtOCO, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
606	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	4-NO ₂ -1-pyrazolyl, H	H, H	EtOCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
607	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	4-NO ₂ -1-pyrazolyl, H	H, H	EtOCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
608	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	4-NO ₂ -1-pyrazolyl, H	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
609	m-Cl-C ₆ H ₄	C=O	4-NO ₂ -1-pyrazolyl, H	H, H	Me, Me	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
610	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	5-NO ₂ -1-pyrazolyl, H	H, H	Me, Me	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
611	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	4-CH ₃ -1-pyrazolyl, H	H, H	MeOCH ₃ CO, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
612	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	4-CH ₃ -1-pyrazolyl, H	H, H	MeOCH ₃ CO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
613	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	4-CH ₃ -1-pyrazolyl, H	H, H	MeCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
614	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	4-CH ₃ -1-pyrazolyl, H	H, H	MeCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
615	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	4-CH ₃ -1-pyrazolyl, H	H, H	EtOCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
616	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	4-CH ₃ -1-pyrazolyl, H	H, H	EtOCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
617	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	4-CH ₃ -1-pyrazolyl, H	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
618	m-Cl-C ₆ H ₄	C=O	4-CH ₃ -1-pyrazolyl, H	H, H	Me, Me	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
619	m-Cl-C ₆ H ₄	C=O	5-CH ₃ -1-pyrazolyl, H	H, H	Me, Me	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
620	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	5-CH ₃ -1-pyrazolyl, H	H, H	MeOCH ₃ CO, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
621	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	5-CH ₃ -1-pyrazolyl, H	H, H	MeOCH ₃ CO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
622	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	5-CH ₃ -1-pyrazolyl, H	H, H	MeCO, H	p-Br-C ₆ H ₄ , H	0	

[0281]

40 [表37]

141

142

化合物 No.	R ¹	A-C-B	R ² , R ³	R ⁴ , R ⁵	R ⁶ , R ⁷	R ⁸ , R ⁹	X	融点 (°C)
623	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	5-CN-1-pyrazolyl, H	H, H	MeCOO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
624	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	1-Me-3-pyrazolyl, H	H, H	MeCOO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
625	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	1-Me-4-pyrazolyl, H	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
626	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	1-Me-5-pyrazolyl, H	H, H	EtCOO, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
627	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	1-imidazolyl, H	H, H	MeCOO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
628	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	1-imidazolyl, H	H, H	MeCOO, Me	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
629	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	2-Cl-1-imidazolyl, H	H, H	EtCOO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
630	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	4-Cl-1-imidazolyl, H	H, H	Me, Et	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
631	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	5-CF ₃ -1-imidazolyl, H	H, H	Me, Me	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
632	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	2,4,5-Me ₃ -1-imidazolyl, H	H, H	Me, Me	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
633	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	1-Me-2-imidazolyl, H	H, H	MeCOO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
634	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	1-Me-4-imidazolyl, H	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
635	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	1-Et-5-imidazolyl, H	H, H	EtCOO, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
636	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	1-Me-2,4-Cl ₂ -5-imidazolyl, H	H, H	Me, Me	p-Br-C ₆ H ₄ , H	0	
637	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	1,2,3-Triazol-1-yl, H	H, H	MeCOO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
638	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	1,2,3-Triazol-1-yl, H	H, H	EtCOO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
639	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	2H-1,2,3-Triazol-2-yl, H	H, H	MeCOO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
640	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	2H-1,2,3-Triazol-2-yl, H	H, H	EtCOO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
641	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	1,2,4-Triazol-1-yl, H	H, H	MeCOO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
642	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	1,2,4-Triazol-1-yl, H	H, H	EtCOO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	134-135

[0282]

40 [表38]

143

144

化合物 No.	R ¹	A-C-B	R ² , R ³	R ⁴ , R ⁵	R ⁶ , R ⁷	R ⁸ , R ⁹	X	融点 (°C)
643	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	1,2,4-Triazol-1-yl, H	H, H	Me, Me	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	74.7/72.0 ¹⁾
644	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	1,2,4-Triazol-1-yl, H	H, H	Me, Me	m-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
645	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	Tetrazol-1-yl, H	H, H	MeCOO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
646	m-Cl-C ₆ H ₄	C=O	Tetrazol-1-yl, H	H, H	EtOCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
647	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	2H-Tetrazol-2-yl, H	H, H	Me, Me	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
648	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	2H-Tetrazol-2-yl, H	H, H	Me, Me	m-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
649	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	4-Oxazolyl, H	H, H	EtOCO, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
650	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	5-Isoxazolyl, H	H, H	EtOCO, H	p-Br-C ₆ H ₄ , H	0	
651	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	1,2,4-Oxadiazol-3-yl, H	H, H	EtOCO, H	p-Br-C ₆ H ₄ , H	0	
652	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	4-Thiazolyl, H	H, H	EtOCO, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
653	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	2-CF ₃ -4-thiazolyl, H	H, H	Me, Me	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
654	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	2-Me-5-thiazolyl, H	H, H	MeCOO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
655	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	2-CF ₃ -5-thiazolyl, H	H, H	EtOCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
656	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	2-Cl-5-thiazolyl, H	H, H	EtOCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	74.7/72.0 ¹⁾
657	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	2-Cl-5-thiazolyl, H	H, H	Me, Me	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	74.7/72.0 ¹⁾
658	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	5-Isotiazolyl, H	H, H	EtOCO, H	p-Br-C ₆ H ₄ , H	0	
659	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	1,2,4-Thiadiazol-3-yl, H	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
660	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	2-Pyridyl, H	H, H	MeCOO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
661	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	3-Pyridyl, H	H, H	MeCOO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
662	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	4-Pyridyl, H	H, H	EtOCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
663	p-F-C ₆ H ₄	C=O	5-F-2-pyridyl, H	H, H	MeCOO, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
664	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	5-F-2-pyridyl, H	H, H	MeCOO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	

[0283]

40 [発39]

145

146

化合物 No.	R ¹	A-C-B	R ² , R ³	R ⁴ , R ⁵	R ⁶ , R ⁷	R ⁸ , R ⁹	X	融点 (°C)
665	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	5-Cl-2-pyridyl, H	H, H	MeOCH ₂ CO, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
666	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	5-Cl-2-pyridyl, H	H, H	MeOCH ₂ CO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
667	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	5-Cl-2-pyridyl, H	H, H	MeSCH ₂ CO, H	p-I-C ₆ H ₄ , H	0	
668	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	5-Cl-2-pyridyl, H	H, H	MeOCH ₂ CO, H	p-CH ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
669	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	5-Cl-2-pyridyl, H	H, H	MeOCH ₂ CO, H	p-SF ₅ -C ₆ H ₄ , H	0	
670	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	5-Cl-2-pyridyl, H	H, H	EtOCH ₂ CO, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	763771 ¹¹
671	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	5-Cl-2-pyridyl, H	H, H	EtOCH ₂ CO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	763771 ¹⁰
672	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	5-Cl-2-pyridyl, H	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	763771 ¹¹
673	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	5-Cl-2-pyridyl, H	H, H	Me, Me	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	763771 ¹⁰
674	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	5-Br-2-pyridyl, H	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
675	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	3, 5-Cl ₂ -2-pyridyl, H	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
676	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	4, 5-Cl ₂ -2-pyridyl, H	H, H	EtOCH ₂ CO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
677	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	3-Cl-5-CF ₃ -2-pyridyl, H	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
678	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	3, 4, 5-Cl ₃ -2-pyridyl, H	H, H	MeOCH ₂ CO, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
679	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	5-1-2-pyridyl, H	H, H	Me, Me	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
680	p-F-C ₆ H ₄	C=O	6-Cl-3-pyridyl, H	H, H	MeOCH ₂ CO, H	p-F-C ₆ H ₄ , H	0	
681	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	6-F-3-pyridyl, H	H, H	t-BuOCH ₂ CO, H	p-CH ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
682	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	6-Cl-3-pyridyl, H	H, H	MeOCH ₂ CO, H	p-F-C ₆ H ₄ , H	0	
683	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	6-Cl-3-pyridyl, H	H, H	MeOCH ₂ CO, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	763771 ¹³
684	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	6-Cl-3-pyridyl, H	H, H	MeOCH ₂ CO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	763771 ¹⁴
685	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	6-Cl-3-pyridyl, H	H, H	MeOCH ₂ CO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	763771 ¹⁵
686	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	6-Cl-3-pyridyl, H	H, H	MeOCH ₂ CO, H	p-CH ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
687	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	6-Cl-3-pyridyl, H	H, H	MeOCH ₂ CO, H	p-SF ₅ -C ₆ H ₄ , H	0	

[0284]

40 【表40】

147

148

化合物 No.	R ¹	A-C-B	R ² , R ³	R ⁴ , R ⁵	R ⁶ , R ⁷	R ⁸ , R ⁹	X	融点 (°C)
688	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	6-Cl-3-pyridyl, H	H, H	EtOCO, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	177-180
689	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	6-Cl-3-pyridyl, H	H, H	EtOCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	142-146
690	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	6-Cl-3-pyridyl, H	H, H	t-BuOCO, H	p-CH ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
691	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	6-Cl-3-pyridyl, H	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	76377λ ⁽¹⁰⁾
692	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	6-Cl-3-pyridyl, H	H, H	Me, Me	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	76377λ ⁽¹¹⁾
693	m-Cl-C ₆ H ₄	C=O	6-Cl-3-pyridyl, H	H, H	EtOCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	76377λ ⁽¹⁰⁾
694	m-Cl-C ₆ H ₄	C=O	6-Cl-3-pyridyl, H	H, H	EtOCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
695	m-Cl-C ₆ H ₄	C=O	6-Cl-3-pyridyl, H	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
696	m-Cl-C ₆ H ₄	C=O	6-Cl-3-pyridyl, H	H, H	Me, Me	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
697	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	6-CF ₃ -3-pyridyl, H	H, H	EtOCO, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
698	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	6-CF ₃ -3-pyridyl, H	H, H	EtOCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
699	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	4, 6-Cl ₂ -3-pyridyl, H	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
700	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	4-Cl-6-CF ₃ -3-pyridyl, H	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
701	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	Isidazo[1,2-a]pyridin-2-yl, H	H, H	MeOCO, Me	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
702	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	Isidazo[1,2-a]pyridin-2-yl, H	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
703	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	Isidazo[1,2-a]pyridin-3-yl, H	H, H	MeOCO, Me	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
704	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	Isidazo[1,2-a]pyridin-3-yl, H	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
705	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	Isidazo[1,2-a]pyridin-5-yl, H	H, H	MeOCO, Me	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	

[0285]

40 【表41】

149

150

化合物 No.	R ¹	A-C-B	R ² , R ³ , R ⁴	R ⁵ , R ⁶	R ⁷ , R ⁸	R ⁹ , R ¹⁰	R ¹¹ , R ¹²	X	融点 (°C)
706	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	Imidazo[1,2-a]pyridin-5-yl, H	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	0	
707	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	Imidazo[1,2-a]pyridin-6-yl, H	H, H	MeCOO, Me	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	0	
708	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	Imidazo[1,2-a]pyridin-6-yl, H	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	0	
709	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	Imidazo[1,2-a]pyridin-7-yl, H	H, H	MeCOO, Me	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	0	
710	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	Imidazo[1,2-a]pyridin-7-yl, H	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	0	
711	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	Imidazo[1,2-a]pyridin-8-yl, H	H, H	MeCOO, Me	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	0	
712	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	Imidazo[1,2-a]pyridin-8-yl, H	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	0	
713	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	3-F-imidazo[1,2-a]pyridin-8-yl, H	H, H	Me, Me	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	0	
714	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	3-Cl-imidazo[1,2-a]pyridin-8-yl, H	H, H	MeCOCH ₃ CO, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	0	
715	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	3-Cl-imidazo[1,2-a]pyridin-8-yl, H	H, H	MeCOCH ₃ CO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	0	
716	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	3-Br-imidazo[1,2-a]pyridin-8-yl, H	H, H	EtOCO, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	0	746.7, 747.0
717	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	3-Br-imidazo[1,2-a]pyridin-8-yl, H	H, H	EtOCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	0	746.7, 747.0

[0286]

40 【表42】

151

152

化合物 No.	R ¹	A-C-B	R ² , R ³	R ⁴ , R ⁵	R ⁶ , R ⁷	R ⁸ , R ⁹	X	融点 (°C)
718	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	3-Br-isidazo[1,2-a] pyridin-8-yl, H	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	745/745
719	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	3-Br-isidazo[1,2-a] pyridin-8-yl, H	H, H	Me, Me	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	745/745
720	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	3-CF ₃ -isidazo[1,2-a] pyridin-8-yl, H	H, H	MeOCH ₃ CO, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
721	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	3-CF ₃ -isidazo[1,2-a] pyridin-8-yl, H	H, H	MeOCH ₃ CO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
722	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	3-CF ₃ -isidazo[1,2-a] pyridin-8-yl, H	H, H	EtOCO, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
723	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	3-CF ₃ -isidazo[1,2-a] pyridin-8-yl, H	H, H	EtOCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
724	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	3-CF ₃ -isidazo[1,2-a] pyridin-8-yl, H	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
725	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	3-CF ₃ -isidazo[1,2-a] pyridin-8-yl, H	H, H	Me, Me	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
726	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	3-CF ₃ -isidazo[1,2-a] pyridin-8-yl, H	H, H	Me, Me	p-CH ₂ F-C ₆ H ₄ , H	0	
727	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	3-CN-isidazo[1,2-a] pyridin-8-yl, H	H, H	MeOCH ₃ CO, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
728	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	3-CN-isidazo[1,2-a] pyridin-8-yl, H	H, H	MeOCH ₃ CO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
729	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	3-CN-isidazo[1,2-a] pyridin-8-yl, H	H, H	EtOCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	

[0287]

40 [表43]

153

154

化合物 No.	R ¹	A-C-B	R ² , R ³	R ⁴ , R ⁵	R ⁶ , R ⁷	R ⁸ , R ⁹	X	融点 (°C)
730	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	3-CN-imidazo[1,2-a] pyridin-8-yl, H	H, H	EtOCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
731	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	3-CN-imidazo[1,2-a] pyridin-8-yl, H	H, H	Me, Me	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
732	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	3-CN-imidazo[1,2-a] pyridin-8-yl, H	H, H	Me, Me	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
733	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	3-NO ₂ -imidazo[1,2-a] pyridin-8-yl, H	H, H	MeOCH ₂ CO, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
734	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	3-NO ₂ -imidazo[1,2-a] pyridin-8-yl, H	H, H	MeOCH ₂ CO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
735	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	3-CMO-imidazo[1,2-a] pyridin-8-yl, H	H, H	EtOCO, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
736	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	3-CMO-imidazo[1,2-a] pyridin-8-yl, H	H, H	EtOCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
737	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	3-CO ₂ Me-imidazo[1,2-a] pyridin-8-yl, H	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
738	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	3-CO ₂ Et-imidazo[1,2-a] pyridin-8-yl, H	H, H	Me, Me	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
739	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	3-CONMe ₂ -imidazo[1,2-a] pyridin-8-yl, H	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
740	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	3-CONMe ₂ -imidazo[1,2-a] pyridin-8-yl, H	H, H	Me, Me	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
741	6-Cl-2-naphthyl	C=O	3-Cl-imidazo[1,2-a] pyridin-8-yl, H	H, H	EtOCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	

[0288]

40 【表44】

155

156

化合物 No.	R ¹	A-C-B	R ² , R ³	R ⁴ , R ⁵	R ⁶ , R ⁷	R ⁸ , R ⁹	X	融点 (°C)
742	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	Ph, H	H, H	EtOCO, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	S	
743	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	MeOCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	S	
744	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	MeOCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	S	
745	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	EtOCO, H	Ph, H	S	135-137
746	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	EtOCO, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	S	143-145
747	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	p-Cl-C ₆ H ₄ MeCO, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	S	179-185
748	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	p-Cl-C ₆ H ₄ MeCS, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	S	211
749	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	S	74-77, 140
750	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	Me, Me	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	S	
751	6-Cl-3-pyridyl	C=O	Ph, H	H, H	EtOCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	S	
752	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	5-Cl-2-pyridyl, H	H, H	MeOCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	S	
753	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	Isidazo[1,2-a] pyridin-5-yl, H	H, H	EtOCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	S	
754	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	Ph, H	H, H	EtOCO, H	3-Pyridyl, H	O	
755	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	EtOCO, H	t-Bu, H	O	75-77, 141
756	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	Me, Me	t-Bu, H	O	
757	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	MeOCO, H	Cyclohexyl, H	O	
758	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	MeOCO, H	2-Cl-5-thiazolyl-CH ₃ , H	S	
759	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	EtOCO, H	3-Cl-Isidazo[1,2-a] pyridin-8-yl, H	O	
760	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	Me, H	MeOCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	O	
761	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	Me, H	EtOCO, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	O	120-122
762	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	Me, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	O	75-77, 140
763	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	Me, Me	MeOCO, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	O	

[0289]

40 [表45]

157

158

化合物 No.	R ¹	A-C-B	R ² , R ³	R ⁴ , R ⁵	R ⁶ , R ⁷	R ⁸ , R ⁹	X	融点 (°C)
764	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	t-Bu, H	H, H	MeOCH ₃ , H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
765	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	Cyclohexyl, H	H, H	MeOCH ₃ , H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	76.7/121
766	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ CH ₂ , H	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	76.7/121
767	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	PhCH ₂ , H	H, H	MeOCH ₃ , H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
768	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ , Me	H, H	MeOCH ₃ CO, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
769	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ , Me	H, H	EtOCH ₃ , H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
770	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ CH ₂ , Me	H, H	MeOCH ₃ , H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
771	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	i-PrO, H	H, H	MeOCH ₃ CO, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
772	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ CO, H	H, H	EtOCH ₃ , H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	162-164
773	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	PhO, Me	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
774	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	MeS, H	H, H	EtOCH ₃ , H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
775	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	PhS, H	H, H	EtOCH ₃ , H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	115-118
776	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	PhS, H	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	90.7/111
777	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	PhS(O), H	H, H	EtOCH ₃ , H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	170-173
778	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	Me ₂ Si, Me	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
779	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	Me ₂ N, H	H, H	EtOCH ₃ , H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
780	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ NH ₂ , H	H, H	EtOCH ₃ , H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
781	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ NH ₂ , H	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	162-164
782	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ N(Me), H	H, H	EtOCH ₃ , H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
783	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ N(Me), H	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	90.7/110
784	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ N(CO ₂ Me), H	H, H	EtOCH ₃ , H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	103-106
785	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ N(CO ₂ Me), H	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	76.7/121
786	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ CONH ₂ , H	H, H	EtOCH ₃ , H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	76.7/121
787	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ CONH ₂ , H	H, H	EtOCH ₃ , H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	76.7/121

[0290]

40 [表46]

159

160

化合物 No.	R ¹	A-C-B	R ² , R ³	R ⁴ , R ⁵	R ⁶ , R ⁷	R ⁸ , R ⁹	X	融点 (°C)
788	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ CONH ₂ , H	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	756/7, 757/7, 758/7
789	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ CONH ₂ , H	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	756/7, 757/7, 758/7
790	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	t-BuCONH ₂ , H	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	756/7, 757/7, 758/7
791	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	t-BuCO ₂ , H	H, H	MeOCH ₃ CO ₂ , H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	756/7, 757/7, 758/7
792	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	EtOCO ₂ , H	H, H	MeOCH ₃ CO ₂ , H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	756/7, 757/7, 758/7
793	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	PhCO ₂ , H	H, H	EtOCO ₂ , H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	756/7, 757/7, 758/7
794	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ CO ₂ , H	H, H	EtOCO ₂ , H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	756/7, 757/7, 758/7
795	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ CO ₂ , Me	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	756/7, 757/7, 758/7
796	6-Cl-2-naphthyl	C=O	p-F-C ₆ H ₄ CO ₂ , H	H, H	EtOCO ₂ , H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	756/7, 757/7, 758/7
797	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ CO ₂ , H	H, H	EtOCO ₂ , H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	756/7, 757/7, 758/7
798	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ CO ₂ , H	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	756/7, 757/7, 758/7
799	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ CO ₂ , H	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	756/7, 757/7, 758/7
800	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	2, 4-Cl ₂ -C ₆ H ₃ CO ₂ , H	H, H	MeOCO ₂ , H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	756/7, 757/7, 758/7
801	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	2, 5-Cl ₂ -4-Cl-C ₆ H ₃ CO ₂ , H	H, H	MeOCO ₂ , H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	756/7, 757/7, 758/7
802	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	(CH ₃) ₂ C=CH-C ₆ H ₄ CO ₂ , H	H, H	MeOCO ₂ , H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	756/7, 757/7, 758/7
803	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	CH ₃ CH ₂ COCH ₂ CH ₂ CO ₂ , H	H, H	MeOCO ₂ , H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	756/7, 757/7, 758/7
804	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	H, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	Ac, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	150-160
805	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	H, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	55-56
806	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	H, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	MeOCO ₂ , H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	55-56
807	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	H, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	EtOCO ₂ , H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	55-56
808	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	Me, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	MeOCO ₂ , H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	55-56
809	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	Ph, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	MeOCO ₂ , H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	55-56
810	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	EtOCO ₂ , H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	55-56
811	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	PhCH ₂ , H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	MeOCO ₂ , H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	55-56

161

162

化合物 No.	R ¹	A-C-B	R ¹ , R ²	R ³ , R ⁴	R ¹ , R ²	R ¹ , R ²	X	融点 (°C)
812	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	MeOCH ₂ CO, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , Me	0	75.5, 7.5 ¹¹⁾
813	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	EtOCO, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , Me	0	
814	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	EtOCO, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , Et	0	
815	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	EtOCO, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , Cyclopropyl	0	
816	p-F-C ₆ H ₄	C=O	p-CHF ₂ -C ₆ H ₄ , H	H, H	EtOCO, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , Me	0	
817	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	EtOCO, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , Me	0	
818	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , Me	0	75.5, 7.5 ¹¹⁾
819	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , Me	0	
820	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , Me	0	
821	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	1-Pyrazolyl, H	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , Me	0	
822	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	5-Cl-2-pyridyl, H	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , Me	0	
823	p-Cl-C ₆ H ₄	C=O	β-Cl-3-pyridyl, H	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , Me	0	
824	p-Cl-C ₆ H ₄	C-S	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , Me	0	
825	p-Cl-C ₆ H ₄	C-S	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	Ac, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
826	p-Cl-C ₆ H ₄	C-S	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	MeOCH ₂ CO, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
827	p-Cl-C ₆ H ₄	C-S	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	MeOCO, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
828	p-Cl-C ₆ H ₄	C-S	p-CHF ₂ -C ₆ H ₄ , H	H, H	EtOCO, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
829	p-Cl-C ₆ H ₄	C-S	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	EtOCO, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
830	p-F-C ₆ H ₄	C-S	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	EtOCO, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
831	p-Cl-C ₆ H ₄	C(OMe) ₂	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	MeOCH ₂ CO, H	p-F-C ₆ H ₄ , H	0	
832	p-Cl-C ₆ H ₄	C(OMe) ₂	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	Ac, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
833	p-Cl-C ₆ H ₄	C(OMe) ₂	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	MeOCH ₂ CO, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
834	p-Cl-C ₆ H ₄	C(OMe) ₂	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	MeOCO, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
835	p-Cl-C ₆ H ₄	C(OMe) ₂	p-CHF ₂ -C ₆ H ₄ , H	H, H	EtOCO, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	

[0292]

40 [表48]

163

164

化合物 No.	R ¹	A-C-B	R ² , R ³	R ⁴ , R ⁵	R ⁴ , R ⁵	R ⁴ , R ⁵	R ⁶ , R ⁷	X	融点 (°C)
836	p-Cl-C ₆ H ₄	C(OMe) ₂	p-CF ₃ -SO ₂ -C ₆ H ₄ , H	H, H	H, H	EtOCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
837	p-Cl-C ₆ H ₄	C(OMe) ₂	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	H, H	EtOCO, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
838	p-Cl-C ₆ H ₄	C(OMe) ₂	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
839	p-Cl-C ₆ H ₄	C(OMe) ₂	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
840	p-Cl-C ₆ H ₄	C-ANMe ₂	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	H, H	Me, Me	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
841	p-Cl-C ₆ H ₄	C-ANMe ₂	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	H, H	H, H	MeOCO, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	164-165
842	p-Cl-C ₆ H ₄	C-ANMe ₂	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	H, H	PrOCO, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	172-173
843	p-Cl-C ₆ H ₄	CH ₃	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	H, H	Ac, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	187-190
844	p-Cl-C ₆ H ₄	CH ₃	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	H, H	Ac, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	172-174
845	p-Cl-C ₆ H ₄	CH ₃	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	H, H	EtOCO, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	166-168
846	p-Cl-C ₆ H ₄	CH ₃	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	H, H	EtOCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	151-152
847	p-Cl-C ₆ H ₄	CH ₃	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	H, H	t-BuOCO, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	90.7 ¹⁰⁾
848	p-Cl-C ₆ H ₄	CH ₃	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	74.67, 1.40)
849	p-Cl-C ₆ H ₄	CH ₃	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	H, H	Me, Me	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
850	p-Cl-C ₆ H ₄	CH ₃	p-Cl-C ₆ H ₄ CO, H	H, H	H, H	EtOCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	
851	p-Cl-C ₆ H ₄	CH ₃	p-Cl-C ₆ H ₄ CO, Me	H, H	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
852	p-Cl-C ₆ H ₄	CH ₃	H, H	H, H	H, H	EtOCO, H	p-CF ₃ -C ₆ H ₄ , H	0	152-154 (Ref大)
853	p-Cl-C ₆ H ₄	CH(OH)	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	73-76 (Ref小)
854	p-Cl-C ₆ H ₄	CH(OH)	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	115-118 (Ref大)
855	p-Cl-C ₆ H ₄	CH(OH)	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	H, H	Ac, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	(Ref小) ¹¹⁾
856	p-Cl-C ₆ H ₄	CH(OH)	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	H, H	Ac, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	(Ref大)
857	p-Cl-C ₆ H ₄	CH(OMe)	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	H, H	Ac, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	(Ref小)
858	p-Cl-C ₆ H ₄	CH(OMe)	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	H, H	Ac, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	(Ref大)
859	p-Cl-C ₆ H ₄	CH(OPh)	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	H, H	Ac, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	(Ref大)

[0293]

40 [表49]

化合物 No.	R ¹	A-C-B	R ¹ , R ²	R ¹ , R ³	R ¹ , R ⁴	R ¹ , R ⁵	X	融点 (°C)
860	p-Cl-C ₆ H ₄	CH(OPh)	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	Ac, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	(融小)
861	p-Cl-C ₆ H ₄	CH(OAc)	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	Ac, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	(融大)
862	p-Cl-C ₆ H ₄	CH(OAc)	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	Ac, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	(融小)
863	p-Cl-C ₆ H ₄	CH(OMe)	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	215 (分解)
864	p-Cl-C ₆ H ₄	CH(SH)	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
865	p-Cl-C ₆ H ₄	CH(SMe)	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	Me, Me	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
866	p-Cl-C ₆ H ₄	CHNMe ₂	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	EtOCO, H	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	0	
867	p-Cl-C ₆ H ₄	CHNHPPh	p-Cl-C ₆ H ₄ , H	H, H	Me, Me	p-CH ₂ O-C ₆ H ₄ , H	0	

1) NMR (CDCl₃): 1.94 (3H, s), 2.50 (3H, s), 3.53 (1H, dd, J=13.8, 8.2 Hz), 3.90 (1H, dd, J=13.8, 5.8 Hz), 5.52 (1H, dd, J=8.2, 5.8 Hz), 7.22-7.40 (5H, m), 7.52-7.63 (4H, m), 8.12-8.18 (1H, m), 8.78 (1H, s), 8.90-8.91 (1H, m).

2) NMR (CDCl₃): 1.82 (3H, s), 2.50 (3H, s), 3.88 (1H, dd, J=14.2, 9.8 Hz), 4.05 (1H, dd, J=14.2, 4.2 Hz), 6.25-6.27 (1H, m), 6.59 (1H, dd, J=9.8, 4.2 Hz), 7.32-7.55 (8H, m), 7.78-7.84 (2H, m), 8.82 (1H, br).

3) NMR (CDCl₃): 1.32 (3H, t, J=7.0 Hz), 4.00-4.60 (4H, m), 6.23-6.30 (1H, m), 6.90 (1H, br), 7.44-7.60 (3H, m), 7.94-7.98 (2H, m)

4) NMR (CDCl₃): 1.31 (3H, t, J=7.0 Hz), 4.00-4.60 (4H, m), 6.25 (1H, m), 6.84 (1H, br), 7.14-7.18 (2H, m), 7.40-7.51 (5H, m), 7.60 (1H, s), 7.94-7.98 (2H, m)

5) NMR (CDCl₃): 実例 15 に記載。

6) NMR (CDCl₃): 1.90 (3H, s), 2.49 (3H, s), 3.81 (1H, dd, J=14.4, 9.8 Hz), 4.04 (1H, dd, J=14.4, 4.0 Hz), 6.82 (1H, dd, J=9.8, 4.0 Hz), 7.41-7.46 (2H, m), 7.60 (4H, s), 7.91-7.97 (3H, m), 8.36 (1H, s), 8.78 (1H, s).

7) NMR (CDCl₃): 1.31 (3H, t, J=7.0 Hz), 4.00 (1H, br), 4.24 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.40 (1H, br), 5.50 (1H, m), 6.70 (1H, br), 7.38-7.54 (8H, m), 7.94-7.98 (2H, m).

167

8) NMR (CDCl₃): 2.16 (3H, s), 2.41 (3H, s), 3.39 (1H, dd, J=13.8, 8.2 Hz), 3.83 (1H, dd, J=13.8, 6.2 Hz), 5.94 (1H, dd, J=8.2, 6.2 Hz), 7.41-7.50 (3H, m), 7.59 (4H, s), 8.08-8.12 (2H, m), 8.76 (1H, s).

9) NMR (CDCl₃): 1.33 (3H, t, J=7.2 Hz), 3.20-3.40 (1H, m), 3.60-4.00 (2H, m), 5.05 (1H, m), 7.18-7.39 (1H, m), 7.50-7.60 (2H, m), 7.55 (1H, br), 7.89-7.94 (2H, m), 8.47 (1H, d, J=2.4 Hz).

10) NMR (CDCl₃): 1.33 (3H, t, J=7.2 Hz), 3.20-3.40 (1H, m), 3.70-4.00 (2H, m), 5.06 (1H, m), 7.27 (1H, br), 7.35-7.39 (2H, m), 7.51 (4H, s), 7.60 (1H, dd, J=8.2, 2.4 Hz), 7.77 (2H, br), 7.89-7.94 (2H, m), 8.48 (1H, d, J=2.4 Hz).

(85)

11) NMR (CDCl₃): 1.95 (3H, s), 2.49 (3H, s), 3.76 (1H, dd, J=13.8, 8.2 Hz), 4.05 (1H, dd, J=13.8, 5.6 Hz), 5.72 (1H, dd, J=8.2, 5.6 Hz), 7.45-7.24 (7H, m), 7.61 (1H, dd, J=8.4, 2.6 Hz), 7.86-7.91 (2H, m), 8.45 (1H, d, J=2.6 Hz), 8.60 (1H, s).

12) NMR (CDCl₃): 1.96 (3H, s), 2.51 (3H, s), 3.79 (1H, dd, J=13.6, 8.4 Hz), 4.06 (1H, dd, J=13.6, 5.8 Hz), 5.71 (1H, dd, J=8.4, 5.8 Hz), 7.32-7.41 (3H, m), 7.56-7.64 (5H, m), 7.85-7.91 (2H, m), 8.47 (1H, d, J=2.6 Hz), 8.80 (1H, s).

13) NMR (CDCl₃): 3.53 (3H, s), 3.85-4.20 (4H, m), 5.28 (1H, dd, J=8.6, 5.2 Hz), 7.18-7.41 (8H, m), 7.58 (1H, dd, J=8.2, 2.6 Hz), 7.84-7.89 (2H, m), 8.35 (1H, d, J=2.2 Hz), 8.41 (1H, s).

14) NMR (CDCl₃): 3.54 (3H, s), 3.90-4.15 (4H, m), 5.28 (1H, dd, J=8.6, 5.6 Hz), 7.31-7.41 (3H, m), 7.52 (5H, br), 7.58 (1H, dd, J=8.4, 2.8 Hz), 7.85-7.89 (2H, m), 8.36 (1H, d, J=2.6 Hz), 8.46 (1H, s).

168

15) NMR (CDCl₃): 3.53 (3H, s), 3.90-4.20 (4H, m), 5.28 (1H, dd, J=8.6, 5.2 Hz), 7.12-7.17 (2H, m), 7.30-7.42 (6H, m), 7.58 (1H, dd, J=8.2, 2.4 Hz), 7.84-7.89 (2H, m), 8.35 (1H, d, J=2.2 Hz), 8.43 (1H, s).

特開平6-287171

16) NMR (CDCl_3): 2.01 (3H, s), 2.46 (3H, s), 3.51 (1H, dd, J=13.6, 7.8 Hz), 3.93 (1H, dd, J=13.6, 6.2 Hz), 5.65 (1H, dd, J=7.8, 6.2 Hz), 7.29-7.25 (2H, m), 7.37-7.44 (4H, m), 7.69 (1H, dd, J=8.2, 2.4 Hz), 7.89-7.94 (2H, m), 8.39 (1H, d, J=2.4 Hz), 8.57 (1H, s).

169

17) NMR (CDCl_3): 2.03 (3H, s), 2.48 (3H, s), 3.54 (1H, dd, J=13.8, 7.8 Hz), 3.96 (1H, dd, J=13.8, 6.2 Hz), 5.64 (1H, dd, J=7.8, 6.2 Hz), 7.44-7.28 (2H, m), 7.52-7.63 (4H, m), 7.70 (1H, dd, J=8.4, 2.6 Hz), 7.88-7.94 (2H, m), 8.40 (1H, d, J=2.6 Hz), 8.79 (1H, s).

18) NMR (CDCl_3): 1.32 (3H, t, J=7.2 Hz), 3.85 (1H, br), 4.15 (1H, br), 4.25 (2H, q, J=7.2 Hz), 5.30 (1H, dd, J=9.8, 4.4 Hz), 7.02 (1H, br), 7.28-7.38 (3H, m), 7.49-7.64 (5H, m), 7.73-7.77 (1H, m), 7.88-7.90 (1H, m), 8.36-8.37 (1H, s).

19) NMR (CDCl_3): 1.22 (3H, t, J=7.0 Hz), 3.80 (1H, br), 4.25 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.80 (1H, br), 5.60-5.70 (1H, m), 6.87 (1H, t, J=7.0 Hz), 7.08-7.32 (8 H, m), 7.71 (1H, s), 7.82-7.87 (2H, m), 7.98-8.02 (1H, m), 8.70 (1H, br).

(86)

20) NMR (CDCl_3): 1.32 (3H, t, J=7.0 Hz), 3.85 (1H, br), 4.28 (2H, q, J=7.0 Hz), 4.80 (1H, br), 5.69 (1H, dd, J=9.5, 5.4 Hz), 6.88 (1H, t, J=7.0 Hz), 7.08-7.12 (1H, m), 7.23-7.58 (7H, m), 7.70 (1H, s), 7.82-7.87 (2H, m), 8.00 (1H, dd, J=6.8, 1.2 Hz), 8.76 (1H, br).

21) NMR (CDCl_3): 2.00 (3H, s), 2.51 (3H, s), 3.82 (1H, dd, J=13.8, 7.2 Hz), 4.24 (1H, dd, J=13.8, 6.2 Hz), 6.70 (1H, t, J=6.6 Hz), 6.89 (1H, t, J=7.0 Hz), 7.19-7.43 (7H, m), 7.64 (1H, s), 8.00-8.03 (2H, m), 8.63 (1H, s).

22) NMR (CDCl_3): 2.04 (3H, s), 2.53 (3H, s), 3.83 (1H, dd, J=13.8, 7.2 Hz), 4.24 (1H, dd, J=13.8, 6.2 Hz), 6.21 (1H, t, J=6.6 Hz), 6.39 (1H, t, J=7.0 Hz), 7.24-7.29 (2H, m), 7.46-7.59 (5H, m), 7.62 (1H, s), 8.00-8.06 (2H, m), 8.73 (1H, s).

23) NMR (CDCl_3): 4.48 (1H, dd, J=13.7, 7.7 Hz), 4.60 (1H, dd, J=13.7, 7.0 Hz), 5.28 (1H, t, J=7.3 Hz), 6.37 (1H, br s), 6.76-6.85 (2H, m), 6.93-7.03 (2 H, m), 7.10-7.40 (12H, m), 7.84-7.95 (2H, m).

170

24) NMR (CDCl_3): 1.94 (3H, s), 2.47 (3H, s), 3.91 (1H, dd, J=14.2, 7.8 Hz), 4.45 (1H, dd, J=14.2, 5.5 Hz), 6.20 (1H, dd, J=7.8, 5.4 Hz), 7.23-7.40 (8H, m), 7.50-7.59 (2H, m), 7.85-7.94 (2H, m), 8.89 (1H, s).

特開平6-287171

25) NMR (CDCl₃): 1.27 (3H, t, J=7.1 Hz), 1.30 (3H, s), 2.71 (1H, br), 4.05 (1H, br), 4.18 (2H, q, J=7.1 Hz), 5.20 (1H, dd, J=9.3, 5.2 Hz), 5.27 (1H, s), 6.66 (1H, br), 7.18-7.38 (5H, m), 7.81-7.89 (2H, m).

26) NMR (CDCl₃): 実施例 17 に記載。

27) NMR (CDCl₃): 2.31 (3H, s), 2.51 (3H, s), 2.91 (1H, dd, J=13.4, 5.8 Hz), 3.02 (1H, dd, J=13.4, 9.4 Hz), 3.42 (1H, dd, J=13.4, 5.6 Hz), 3.55 (1H, dd, J=13.4, 8.4 Hz), 4.64-4.79 (1H, m), 7.06-7.17 (4H, m), 7.26-7.36 (2H, m), 7.55 (4H, s), 7.79-7.86 (2H, m), 8.76 (1H, s).

28) NMR (CDCl₃): 1.27 (3H, t, J=7.2 Hz), 2.80 (1H, dd, J=14.4, 7.2 Hz), 3.03 (1H, dd, J=14.4, 5.6 Hz), 3.65 (1H, br), 4.05 (1H, br), 4.20 (2H, q, J=7.2 Hz), 4.36 (1H, br), 6.74 (1H, s), 7.02-7.26 (4H, m), 7.39-7.58 (7H, m), 7.82-7.88 (2H, m).

29) NMR (CDCl₃): 2.47 (3H, s), 2.59 (3H, s), 3.78 (1H, dd, J=13.4, 6.0 Hz), 3.89 (1H, dd, J=13.4, 8.2 Hz), 5.65 (1H, dd, J=8.2, 6.0 Hz), 7.26-7.46 (7H, m), 7.55-7.60 (4H, m), 7.81-7.85 (2H, m), 8.83 (1H, s).

30) NMR (CDCl₃): 実施例 20 に記載。

31) NMR (CDCl₃): 2.49 (3H, s), 2.53 (3H, s), 3.65 (3H, s), 3.92 (1H, dd, J=12.6, 5.4 Hz), 4.04 (1H, dd, J=13.6, 8.0 Hz), 5.93 (1H, dd, J=8.0, 5.4 Hz), 7.14-7.09 (2H, m), 7.25-7.30 (2H, m), 7.38-7.43 (2H, m), 7.58 (4H, s), 7.88-7.93 (2H, m), 8.88 (1H, s).

32) NMR (CDCl₃): 1.33 (3H, t, J=7.0 Hz), 3.50-4.50 (2H, br), 4.28 (2H, q, J=7.0 Hz), 5.85 (1H, m), 7.15 (4H, m), 7.29-7.70 (3H, m), 7.91-7.96 (2H, m), 8.09 (1H, br).

33) NMR (CDCl₃): 1.34 (3H, t, J=7.2 Hz), 3.60-4.00 (1H, br), 4.10-4.50 (1H, m), 4.29 (2H, q, J=7.2 Hz), 5.86 (1H, m), 7.29-7.70 (12H, m), 7.92-7.97 (2H, m), 8.13 (1H, br).

34) NMR (CDCl₃): 2.50 (3H, s), 2.64 (3H, s), 3.65 (1H, dd, J=15.2, 4.0 Hz), 3.94 (1H, dd, J=15.2, 9.6 Hz), 5.77 (1H, m), 7.23-7.51 (3H, m), 7.77-7.81 (2H, m), 8.09-8.14 (2H, m), 8.29 (1H, d, J=6.6 Hz), 8.59 (1H, s).

173

35) NMR (CDCl₃): 2.51 (3H, s), 2.63 (3H, s), 3.68 (1H, dd, J=15.0, 4.2 Hz), 3.92 (1H, dd, J=15.0, 9.6 Hz), 5.85 (1H, m), 7.34-7.50 (4H, m), 7.55 (4H, s), 7.81 (2H, m), 8.09-8.14 (2H, m), 8.21 (1H, d, J=8.6 Hz), 8.80 (1H, s).

36) NMR (CDCl₃): 実施例21に記載。

37) NMR (CDCl₃): 実施例23に記載。

38) NMR (CDCl₃): 1.80 (6H, br s), 3.15 (3H, s), 3.43 (1H, dd, J=12.8, 7.9 Hz), 3.77 (1H, dd, J=12.8, 6.9 Hz), 5.32 (1H, dd, J=7.9, 6.9 Hz), 6.68-6.73 (2H, m), 7.08-7.18 (2H, m), 7.25-7.44 (6H, m), 7.89-7.99 (2H, m).

39) NMR (CDCl₃): 2.07 (3H, s), 2.45 (3H, s), 2.72-2.94 (1H, m), 3.05-3.32 (2H, m), 3.54-3.75 (2H, m), 6.91-7.31 (10H, m), 7.39-7.49 (2H, m), 8.61 (1H, s).

40) NMR (CDCl₃): 2.08 (3H, s), 2.47 (3H, s), 2.78-2.95 (1H, m), 3.05-3.33 (2H, m), 3.55-3.75 (2H, m), 6.93-7.28 (8H, m), 7.50-7.66 (4H, m), 8.81 (1H, s).

41) NMR (CDCl₃): 1.81 (3H, s), 3.10-3.26 (1H, m), 3.70-3.84 (1H, m), 4.03-4.21 (1H, m), 4.67 (1H, d, J=8.6 Hz), 6.75-7.38 (12H, m), 7.66 (1H, m), 7.97 (1H, s).

174

【0298】〔実施例29〕化合物No. 147 (20重量%)、キシレン (75重量%)、ポリオキシエチレングリコールエーテル (ノニポール85 (商品名)) (5重量%) をよく混合して、乳剤を製造した。

【0299】〔実施例30〕化合物No. 211 (30重量%)、リグニンスルホン酸ナトリウム (5重量%)、ポリオキシエチレングリコールエーテル (ノニポール85 (商品名)) (5重量%)、ホワイトカーボン (30重量%)、クレイ (30重量%) をよく混合して、水和

剤を製造した。

【0300】〔実施例31〕化合物No. 471 (3重量%)、ホワイトカーボン (3重量%)、クレイ (94重量%) をよく混合して粉剤を製造した。

【0301】〔実施例32〕化合物No. 853 (10重量%)、リグニンスルホン酸ナトリウム (5重量%)、クレイ (85重量%) をよく粉砕混合し、水を加えてよく練り合わせた後、造粒乾燥して粒剤を製造した。

【0302】

【発明の効果】本発明のセミカルバジド誘導体〔I〕およびその塩は優れた殺虫活性を有している。本発明のセ

ミカルバジド誘導体〔I〕およびその塩を含有する組成物は優れた殺虫剤として有用である。

フロントページの続き

(51) Int. Cl. 8	識別記号	庁内整理番号	F I	技術表示箇所
C 0 7 C 337/06		7106-4H		
C 0 7 D 203/22		7019-4C		
207/325		8217-4C		
207/34		8217-4C		
207/408		8217-4C		
209/48				
213/50				
213/61				
213/75				
213/82				
231/12				
231/14				
231/16				
233/54				
233/68				
233/90	A			
249/14	5 0 7	7167-4C		
257/02		7433-4C		
261/08				
263/32				
271/06				
277/56				
295/22	Z			
307/52				
309/04		9360-4C		
317/66				
333/22				
471/04	1 0 7 Z	7602-4C		
	1 0 8 A	7602-4C		
521/00		8314-4C		

(72)発明者 岡内 哲夫
大阪府枚方市堤町10番11号

131

132

36) NMR (CDCl₃): 1.94 (3H, s), 2.48 (3H, s), 3.54 (1H, dd, J=13.8, 8.2 Hz), 3.94 (1H, dd, J=13.8, 5.8 Hz), 5.57 (1H, dd, J=8.2, 5.8 Hz), 6.54 (1H, t, J=73.0 Hz), 7.07-7.34 (6H, m), 7.52-7.64 (4H, m), 7.95-8.00 (2H, m), 8.80 (1H, s).

37) NMR (CDCl₃): 1.94 (3H, s), 2.47 (3H, s), 3.52 (1H, dd, J=13.6, 8.0 Hz), 3.92 (1H, dd, J=13.6, 5.8 Hz), 5.56 (1H, dd, J=8.0, 5.8 Hz), 7.24-7.48 (10H, m), 7.78-7.82 (1H, m), 7.90-7.92 (1H, m), 8.60 (1H, s).

38) NMR (CDCl₃): 1.95 (3H, s), 2.49 (3H, s), 3.52 (1H, dd, J=13.8, 8.2 Hz), 3.94 (1H, dd, J=13.8, 6.0 Hz), 5.55 (1H, dd, J=8.2, 6.0 Hz), 7.28-7.35 (5H, m), 7.43-7.64 (5H, m), 7.78-7.82 (1H, m), 7.90-7.92 (1H, m), 8.60 (1H, s).

39) NMR (CDCl₃): 1.31 (3H, t, J=7.0 Hz), 3.80 (1H, br), 4.10 (1H, br), 4.25 (2H, q, J=7.0 Hz), 5.22 (1H, dd, J=10.0, 4.6 Hz), 6.95 (1H, br), 7.19-7.34 (5H, m), 7.44-7.50 (1H, m), 7.54 (4H, s), 7.68 (1H, br s), 7.73-7.77 (1H, m), 7.89-7.91 (1H, m).

【0276】

【化29】

【0277】

【表33】

